

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2002 年 6 月 27 日 (27.06.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/49632 A1

(51) 国際特許分類: A61K 31/055,
31/166, 31/12, 31/18, 31/167, 31/136, 31/17, 31/695,
31/5375, 31/357, 31/404, 31/44, 31/498, 31/403, 31/415,
31/421, 31/422, 31/433, 31/428, 31/505, 31/47, 31/40,
31/381, 31/426, 31/437, 31/4402, 31/4453, 31/445, C07D
295/192, 321/10, 213/82, 209/42, 241/44, 209/88, 333/68,
231/40, 263/48, 413/14, 285/12, 213/75, 239/47, 209/08,
209/42, 215/38, 209/88, 207/325, 333/24, 277/30, 471/04,
213/56, 295/192, 211/16, 207/48, 213/76, 277/46, 277/56,
413/14, C07C 235/60, 233/75, A61P 43/00, 19/02, 29/00,
37/06, 17/00, 21/00, 21/04, 9/00, 1/04, 1/16, 13/12, 1/18,
19/06, 9/10, 17/06, 37/08, 11/00, 3/04, 3/10, 3/06, 27/02,
25/28, 35/00, 35/02, 15/00

(30) 優先権データ:
特願 2000-383202

2000 年 12 月 18 日 (18.12.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社
医薬分子設計研究所 (INSTITUTE OF MEDICINAL
MOLECULAR DESIGN, INC.) [JP/JP]; 〒113-0033 東
京都文京区本郷5丁目24番5号 角川本郷ビル4F Tokyo
(JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 武藤 進 (MUTO,
Susumu) [JP/JP]; 〒184-0003 東京都小金井市緑町1-6-7
メイプルコーポB202 Tokyo (JP). 永野辰夫 (NAGANO,
Tatsuo) [JP/JP]; 〒151-0072 東京都渋谷区幡ヶ谷1-7-3
第一西谷ビル401号 Tokyo (JP). 早乙女智美 (SAO-
TOME, Tomomi) [JP/JP]; 〒165-0022 東京都中野区江
古田3-7-14 グリュックハイム206 Tokyo (JP). 板井昭
子 (ITAI, Akiko) [JP/JP]; 〒113-0033 東京都文京区本
郷5-16-6 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/11084

(22) 国際出願日: 2001 年 12 月 18 日 (18.12.2001)

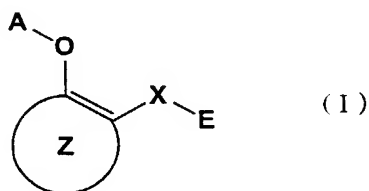
(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

[続葉有]

(54) Title: INHIBITORS AGAINST THE PRODUCTION AND RELEASE OF INFLAMMATORY CYTOKINES

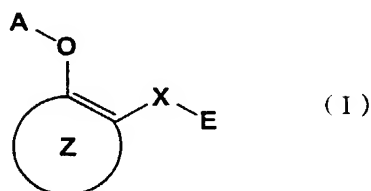
(54) 発明の名称: 炎症性サイトカイン産生遊離抑制剤



(57) Abstract: Medicines having inhibitory activity against the activation of NF-κB, which contain as the active ingredient compounds represented by the general formula (I) (wherein X is a connecting group; A is hydrogen or acetyl; E is aryl or heteroaryl; and Z is arene or heteroarene) or pharmacologically acceptable salts thereof: (I)

(57) 要約:

一般式 (I) (Xは連結基を表し、Aは水素原子又はアセチル基を表し、Eはアリール基又はヘテロアリール基を表し、環Zはアレーン又はヘテロアレーンを表す) で表される化合物又は薬理学的に許容される塩を有効成分として含み、NF-κB活性化阻害作用を有する医薬。:





(74) 代理人: 今村正純, 外(IMAMURA, Masazumi et al.);
〒104-0031 東京都中央区京橋1丁目8番7号 京橋日殖
ビル8階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,
OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

明 細 書

炎症性サイトカイン産生遊離抑制剤

技術分野

本発明は、インターロイキン（IL）-1、IL-6、IL-8、腫瘍壊死因子（TNF- α ）などの炎症性サイトカインの産生遊離抑制作用及びNF- κ B活性化阻害作用を有する医薬に関する。

背景技術

炎症はさまざまな侵襲に対する基本的な生体防御反応であり、そこでは炎症性サイトカインであるインターロイキン（IL）-1やTNF- α （腫瘍壊死因子）が重要な役割を担っていることが知られている。炎症性サイトカインや炎症性細胞接着因子の遺伝子解析が進み、これらが共通の転写因子（転写調節因子とも呼ぶ）で制御されていることが明らかになってきた。この転写因子がNF- κ B（NF κ Bと記されることもある）と呼ばれているタンパク質である（Clark B. D., et al., Nucl. Acids Res., 14, 7898(1984); Nedospasov S. A., et al., Cold Spring Harb. Symp. Quant. Biol., 51, 611(1986))。

このNF- κ Bはp65（Rel Aとも称する）とp50（NF- κ B-1とも称する）とのヘテロ二量体（複合体とも称する）であり、通常、外界刺激の無い状態ではI- κ Bと結合し、不活性型として細胞質に存在する。I- κ Bはさまざまな外界刺激（酸化的ストレス、サイトカイン、リポ多糖、ウイルス、UV、フリーラジカル、プロテインキナーゼCなど）によってリン酸化を受けユビキチン化し、その後プロテアゾームで分解される（Verma I. M., Stevenson J. K., et al., Genes Dev., 9, 2723-2735(1995))。I- κ Bから離れたNF- κ Bは速やかに核内に移行し、NF- κ Bの認識配列を持つプロモーター領域に結合することにより、転写因子としての役割を果たしている。

1997年になって、I- κ Bのリン酸化に関与するリン酸化酵素（I- κ Bキナーゼと称してIKKと略される）が同定された（DiDonato J., Hayakawa M., et al., Nature, 388, 548-554(1997); Regnier C. H., Song H. Y., et al., Cell, 90, 373-383(1997)）。IKKには互いによく似ているIKK- α （IKK1とも称する）とIKK- β （IKK2とも称する）が存在しており、この二つは複合体を形成してI- κ Bと直接結合してI- κ Bをリン酸化することが知られている（Woronicz J. D., et al., Science, 278, 866-869(1997); Zandi, E., et al., Cell, 91, 243-252(1997)）。

最近、抗炎症剤として汎用されているアスピリンにシクロオキシゲナーゼ阻害作用以外の作用機序が想定されており、これらNF- κ B活性化抑制によるものであることが知られている（Kopp E., et al., Science, 265, 956-959(1994)）。さらに、アスピリンはI- κ BキナーゼであるIKK- β にATPと競合して可逆的に結合し、I- κ Bのリン酸化を阻害することで、NF- κ Bの遊離、活性化を抑制していることが明らかになった（Yin M. J., et al., Nature, 396, 77-80(1998)）。しかし、十分にNF- κ B活性化を抑制するためには大用量のアスピリンを投与する必要があり、プロスタグランジン合成阻害による胃腸障害や抗血液凝固作用による出血傾向の増大等の副作用発生が高い確率で起こりえる可能性があることから、長期使用には適さない。

アスピリン以外にもNF- κ B活性化抑制作用を有していることが明らかになった薬剤が知られている。デキサメタゾンなどのグルココルチコイド（ステロイドホルモン）はその受容体（グルココルチコイド受容体と呼ばれている）と結合することによってNF- κ B活性化を抑制しているが（Scheinman R. I., et al., Science, 270, 283(1995)）、感染症の増悪、消化性潰瘍の発生、骨密度の低下、中枢作用などの重篤な副作用があることより長期使用に適さない。免疫抑制剤であるイソキサゾール系薬剤レフルノミドもNF- κ B抑制作用を有しているが（Manna S., et al., J. Immunol., 164, 2095-2102(1999)）、重篤な副作用があることからこれも長期使用には適さない。その他、NF- κ B活性化阻害

剤としては、置換ピリミジン誘導体(特表平 11 - 512399 号公報、特表平 11 - 512399 号公報、J. Med. Chem., 41, 413(1998))、キサンチン誘導体(特開平 9-227561 号公報)、イソキノリン誘導体(特開平 10-87491 号公報)、インダン誘導体(W000/05234 号公報)、エポキシキノマイシン C、D 及びその誘導体(特開平 10-45738 号公報、Bioorg. Med. Chem. Lett., 10, 865-869(2000))が知られているが、NF- κ B 活性化阻害の作用機構及び作用している受容体又は蛋白質については明らかにされていない。

発明の開示

I κ B のリン酸化を直接引き起こす IKK- β をターゲットとして IKK- β 特異的な阻害化合物を見出すことは、他のシグナル伝達経路に影響を及ぼさずに、つまり重篤な副作用を示さずに目的とする炎症性サイトカインの産生遊離抑制作用及び炎症性細胞接着分子の産生抑制を示すことが期待される。また、前記の外界刺激により NF- κ B 活性化がおこり炎症性サイトカインなどのタンパク質が発現していることになるが、炎症性サイトカインの中で、特に TNF- α とインターロイキン(IL)-1 はその遺伝子発現自体が NF- κ B によって正に制御されて正のフィードバック・ループ[TNF- α \rightarrow NF- κ B \rightarrow TNF- α]を構成し、炎症の慢性化の一端を担うものと考えられていることから(第 18 回日本炎症学会、シンポジウム「抗リウマチ薬の作用機序と新しい展開」、東京、2000 年)、上記 IKK- β をターゲットした特異的阻害化合物は慢性化した炎症性疾患並びに TNF- α 、IL-1 により引き起こされる疾患への有用な薬剤になることが期待される。

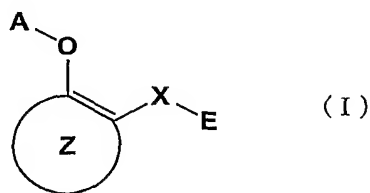
従って、本発明の課題は、炎症性サイトカインが関与している炎症性疾患、慢性関節リウマチなどの自己免疫疾患、骨粗鬆症などの骨疾患などに対する予防及び／又は治療に有用な医薬を提供することにある。また、本発明の別の課題は、IKK- β を特異的に阻害することにより副作用を回避することができ、かつ NF- κ B 活性化阻害作用を有する炎症性サイトカイン産生遊離抑制剤を提供す

ることにある。

本発明者は、上記の課題を解決すべく、コンピューター利用の分子設計技術により IKK- β 選択的阻害による NF- κ B 活性化阻害化合物の探索を実施した。PDB (Protein Data Bank) に構造が登録されているプロテインキナーゼより IKK- β と相同性の高い適切なものを選抜し、それを鋳型としてホモロジーモデリングの手法を用いて IKK- β の立体構造モデルを構築し、タンパク質への薬物分子の結合様式の自動探索プログラムを用い、アスピリンの IKK- β の ATP 結合領域への結合様式と特徴的な分子間相互作用を解析した。その結果に基づいて、リガンドのタンパク質立体構造に基づく化合物 3 次元データベース自動検索プログラムを用い、市販化合物データベースに登録されている化合物の中からヴァーチャルスクリーニングにより IKK- β の特異的阻害剤となり得る化合物を選定し、さらにその化合物について TNF- α 刺激下での NF- κ B 活性化抑制作用をレポーターアッセイ法にて確認した。それらの中で活性の強いものについて IKK- β への結合様式及び相互作用を解析し、その結果に基づいて類縁体の化合物データベースからの探索及び合成を実施して本発明を完成するに至った。

本発明の医薬は、

(1) 下記一般式 (I) :



(式中、

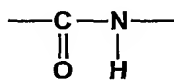
Xは、主鎖の原子数が2ないし4である連結基（該連結基は置換基を有していてもよい）を表し、

Aは、水素原子又はアセチル基を表し、

Eは、置換基を有していてもよいアリール基又は置換基を有していてもよいヘテ

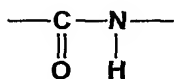
(式中、左側の結合手が環Zに結合し右側の結合手がEに結合する)

(3) Xが、下記式：



(式中、左側の結合手が環Zに結合し右側の結合手がEに結合する)で表される基(該基は置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(4) Xが、下記式：



(式中、左側の結合手が環Zに結合し右側の結合手がEに結合する)で表される基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(5) Aが、水素原子である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(6) 環Zが、C₆~C₁₀のアレーン(該アレーンは、式-O-A(式中、Aは一般式(I)における定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは一般式(I)における定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよい)、又は6ないし13員のヘテロアレーン(該ヘテロアレーンは、式-O-A(式中、Aは一般式(I)における定義と同義である)及び式-X-E(式中、X及びEは一般式(I)における定義と同義である)で表される基の他にさらに置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(7) 環Zが、下記環群 β より選択される環（該環は、式—O—A（式中、Aは一般式（I）における定義と同義である）及び式—X—E（式中、X及びEは一般式（I）における定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよい）である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

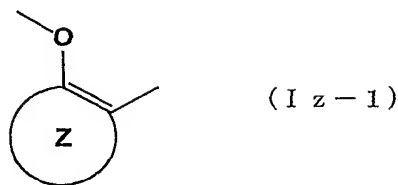
〔環群 β 〕ベンゼン環、ナフタレン環、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、カルバゾール環

(8) 環Zが、式—O—A（式中、Aは一般式（I）における定義と同義である）及び式—X—E（式中、X及びEは一般式（I）における定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

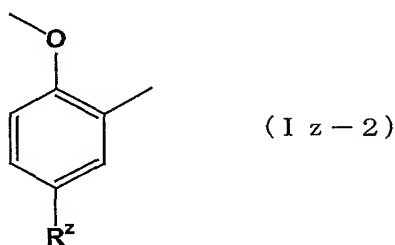
(9) 環Zが、式—O—A（式中、Aは一般式（I）における定義と同義である）及び式—X—E（式中、X及びEは一般式（I）における定義と同義である）で表される基の他に、下記置換基群 $\gamma-1z$ より選択される基をさらに有していてもよいベンゼン環である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

〔置換基群 $\gamma-1z$ 〕ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいアシル基、置換基を有していてもよいウレイド基、置換基を有していてもよいチオウレイド基、置換基を有していてもよいジアゼニル基

(10) 一般式（I）における環Zを含む下記部分構造式（I $z-1$ ）：



が下記式 (I z - 2) :



(式中、

R^z は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいアシル基、置換基を有していてもよいウレイド基、置換基を有していてもよいチオウレイド基、又は置換基を有していてもよいジアゼニル基を表す) である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(11) R^z が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)ーアミノ基、 $C_6 \sim C_{10}$ のアリールーカルボニルーアミノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、 $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基、置換基を有していてもよい5ないし6員のヘテロアリール基、置換基を有していてもよいカルバモイル基、置換基を有していてもよいスルファモイル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキルーカルボニ

ル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基、置換基を有していてもよい5員のヘテロアリールスルホニル基、置換基を有していてもよい6員の非芳香族ヘテロ環スルホニル基、又は置換基を有していてもよいジアゼニル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(12) R^2 が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、メチル基、tert-ブチル基、1-ヒドロキシエチル基、1-(メトキシイミノ)エチル基、1-[(ベンジルオキシ)イミノ]エチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2-フェニルエテン-1-イル基、2,2-ジシアノエテン-1-イル基、2-シアノ-2-(メトキシカルボニル)エテン-1-イル基、2-カルボキシ-2-シアノエテン-1-イル基、エチニル基、フェニルエチニル基、(トリメチルシリル)エチニル基、フェニル基、2-フェネチル基、2-チエニル基、3-チエニル基、1-ピロリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、2-ピリジル基、N-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、ジメチルスルファモイル基、アセチル基、イソブチリル基、メトキシカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、4-ベンジルピペリジノ基、(ピロール-1-イル)スルホニル基、3-フェニルウレイド基、(3-フェニル)チオウレイド基、(4-ニトロフェニル)ジアゼニル基、又は{[(4-ピリジン-2-イル)スルファモイル]フェニル}ジアゼニル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(13) R^2 が、ハロゲン原子である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有

効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(14) Eが、置換基を有していてもよいC₆~C₁₀のアリール基、又は置換基を有していてもよい5ないし13員のヘテロアリール基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(15) Eが、置換基を有していてもよいC₆~C₁₀のアリール基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(16) Eが、置換基を有していてもよいフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(17) Eが、C₁~C₆のハロゲン化アルキル基2個で置換されたフェニル基(該フェニル基はC₁~C₆のハロゲン化アルキル基2個の他にさらに置換基を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(18) Eが、C₁~C₆のハロゲン化アルキル基2個で置換されたフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(19) Eが、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、又は2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(20) Eが、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である化合物及

び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(21) Eが、C₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個で置換されたフェニル基(該フェニル基はC₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個の他にさらに置換基(ただし、C₁～C₆のハロゲン化アルキル基は除く)を有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(22) Eが、C₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個で置換されたフェニル基(該フェニル基はC₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個の他に、下記置換基群 $\gamma-1$ eより選択される基をさらに有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-1$ e] ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいスルファニル基

(23) Eが、C₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個で置換されたフェニル基(該フェニル基はC₁～C₆のハロゲン化アルキル基1個の他に、下記置換基群 $\gamma-2$ eより選択される基をさらに有していてもよい)である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-2$ e] ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換基を有していてもよい5ないし6員の非芳香族ヘテロ環基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルコキシ基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキルスルファニル基

(24) Eが、2-(トリフルオロメチル)フェニル基、3-(トリフルオロメ

チル) フェニル基、4-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-クロロ-4-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-クロロ-2-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-ニトロ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-シアノ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチル-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メチル-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-メチル-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-メトキシ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(メチルスルファニル)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-(1-ピロリジノ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、又は2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(25) Eが、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) フェニル基、2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基、又は3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(26) Eが、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) フェニル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和

物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(27) Eが、置換基（ただし、C₁～C₆のハロゲン化アルキル基は除く）を有していてもよいフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(28) Eが、下記置換基群 $\gamma-3e$ より選択される基を有していてもよいフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-3e$] ハロゲン原子、ニトロ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいアシル基

(29) Eが、下記置換基群 $\gamma-4e$ より選択される基で置換されたフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-4e$] ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル基、置換基を有していてもよいC₆～C₁₀のアリール基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキレン基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルコキシ基置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルキル-カルボニル基、置換基を有していてもよいC₁～C₆のアルコキシ-カルボニル基

(30) Eが、フェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、3,5-ジニトロフェニル基、3,5-ジクロロ-

4-ヒドロキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、5-(1, 1-ジメチル) エチルー2-メトキシフェニル基、3, 5, 5, 8, 8-ペンタメチルー5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル基、ビフェニルー3-イル基、4-メトキシビフェニルー3-イル基、3-アセチルフェニル基、又は3, 5-ビス (メトキシカルボニル) フェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(31) Eが、2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、又は5-(1, 1-ジメチル) エチルー2-メトキシフェニル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(32) Eが、置換基を有していてもよい5ないし13員のヘテロアリアル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(33) Eが、置換基を有していてもよいチエニル基、置換基を有していてもよいピラゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基、置換基を有していてもよいチアゾリル基、置換基を有していてもよいチアジアゾリル基、置換基を有していてもよいピリジル基、置換基を有していてもよいピリミジニル基、置換基を有していてもよいインドリル基、置換基を有していてもよいキノリル基、又は置換基を有していてもよいカルバゾリル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(34) Eが、置換基を有していてもよいチアゾリル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

(35) Eが、下記置換基群 $\gamma-5e$ より選択される基を有していてもよいチアゾリル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-5e$] ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいアシル基

(36) Eが、下記置換基群 $\gamma-6e$ より選択される基を有していてもよいチアゾリル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、

[置換基群 $\gamma-6e$] ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基、置換基を有していてもよい6員の非芳香族ヘテロ環基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル-カルボニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール-カルボニル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ-カルボニル基

(37) Eが、5-ブロモ-4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、5-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-シアノ-4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、4-[(1, 1-ジメチル)エチル]チアゾール-2-イル基、5-フェニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、4-(1, 1-ジメチル)

エチル-5-エチルチアゾール-2-イル基、5-メチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-イソプロピル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-ベンジル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-[(2,2-ジメチル)プロピオニル]チアゾール-2-イル基、5-アセチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-(エトキシカルボニル)チアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-ピペリジノチアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-モルホリノチアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-(4-フェニルピペリジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-(4-メチルピペリジン-1-イル)チアゾール-2-イル基、4,5-ジフェニルチアゾール-2-イル基、4-フェニルチアゾール-2-イル基、4,5-ジメチルチアゾール-2-イル基、2-チアゾリル基、5-メチルチアゾール-2-イル基、4-エチル-5-フェニルチアゾール-2-イル基、5-カルボキシメチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-メチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エチルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-イソプロピルカルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-(2-フェネチル)カルバモイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-(n-ブチル)-5-フェニルチアゾール-2-イル基、4-メチル-5-[(3-トリフルオロメチル)フェニル]チアゾール-2-イル基、又は5-(4-フルオロフェニル)-4-メチルチアゾール-2-イル基である化合物及び薬理学的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬、及び

(38) Eが、4-(1,1-ジメチル)エチル-5-[(2,2-ジメチル)

プロピオニル] チアゾール-2-イル基である化合物及び薬理的に許容されるその塩、並びにそれらの水和物及びそれらの溶媒和物からなる群から選ばれる物質を有効成分として含み、NF- κ B活性化阻害作用を有する医薬である。

本発明の医薬は、下記物質群 δ :

[物質群 δ] 腫瘍壊死因子 (TNF)、インターロイキン-1、インターロイキン-2、インターロイキン-6、インターロイキン-8、顆粒球コロニー刺激因子、インターフェロン β 、細胞接着因子である ICAM-1、VCAM-1、ELAM-1、ニトリックオキシド合成酵素、主要組織適合抗原系クラス I、主要組織適合抗原系クラス II、 β 2-マイクログロブリン、免疫グロブリン軽鎖、血清アミロイド A、アンジオテンシノーゲン、補体 B、補体 C4、c-myc、HIV の遺伝子由来の転写産物、HTLV-1 の遺伝子由来の転写産物、シミアンウイルス 40 の遺伝子由来の転写産物、サイトメガロウイルスの遺伝子由来の転写産物、及びアデノウイルスの遺伝子由来の転写産物

より選択される 1 又は 2 以上の物質の遺伝子の発現抑制剤として用いることができる。

また、本発明の医薬は炎症性サイトカイン産生遊離抑制剤として用いることができ、あるいは免疫抑制剤として用いることができる。本発明の医薬は、下記疾患群 $\varepsilon-1$

[疾患群 $\varepsilon-1$] 炎症性疾患、自己免疫疾患、アレルギー性疾患、癌腫・肉腫等の癌、代謝性疾患、循環器系疾患、血管増殖性疾患、敗血症性疾患、ウイルス性疾患、

又は NF- κ B 活性化又は炎症性サイトカイン産生過剰に起因する下記疾患群 $\varepsilon-2$:

[疾患群 $\varepsilon-2$] 慢性関節リウマチ、変形性関節症、全身性エリテマトーデス、全身性強皮症、多発性筋炎、シェーグレン症候群、血管炎症候群、抗リン脂質抗体症候群、スティル病、ベーチェット病、結節性動脈周囲炎、潰瘍性大腸炎、クローン病、活動性慢性肝炎、糸球体腎炎などの自己免疫疾患、慢性腎炎、慢性膵

炎、痛風、アテローム硬化症、多発性硬化症、動脈硬化、血管内膜肥厚、乾癬、乾癬性関節炎、接触性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、花粉症等のアレルギー疾患、喘息、気管支炎、間質性肺炎、肉芽腫を伴う肺疾患、慢性閉塞性肺疾患、慢性肺血栓塞栓症、炎症性大腸炎、インスリン抵抗性、肥満症、糖尿病とそれに伴う合併症（腎症、網膜症、神経症、高インスリン血症、動脈硬化、高血圧、末梢血管閉塞等）、高脂血症、網膜症等の異常血管増殖を伴った疾患、肺炎、アルツハイマー症、脳脊髄炎、急性肝炎、慢性肝炎、薬物中毒性肝障害、アルコール性肝炎、ウイルス性肝炎、黄疸、肝硬変、肝不全、心房粘液腫、キャッスルマン症候群、メサングウム増殖性腎炎、腎臓癌、肺癌、肝癌、乳癌、子宮癌、膀胱癌、その他の固形癌、肉腫、骨肉腫、癌の転移浸潤、炎症性病巣の癌化、癌性悪液質、癌の転移、急性骨髄芽球性白血病等の白血病、多発性骨髄腫、レンネルトリリンパ腫、悪性リンパ腫、癌の抗癌剤耐性化、ウイルス性肝炎および肝硬変等の病巣の癌化、大腸ポリープからの癌化、脳腫瘍、神経腫瘍、エンドトキシンショック、敗血症、サイトメガロウイルス性肺炎、サイトメガロウイルス性網膜症、アデノウイルス性感冒、アデノウイルス性プール熱、アデノウイルス性眼炎、結膜炎、エイズ、ぶどう膜炎、その他バクテリア・ウイルス・真菌等感染によって惹起される疾患または合併症、全身炎症症候群等の外科手術後の合併症、経皮的経管的冠状動脈形成術後の再狭窄、虚血再灌流障害等の血管閉塞開通後の再灌流障害、心臓または肝臓または腎臓等の臓器移植後拒絶反応及び再灌流障害、掻痒、食欲不振、倦怠感、慢性疲労症候群、骨粗鬆症、骨癌性疼痛等の代謝性骨疾患、移植前臓器保存時の臓器の劣化

より選択される 1 又は 2 以上の疾患の予防及び／又は治療のための医薬として用いることができる。

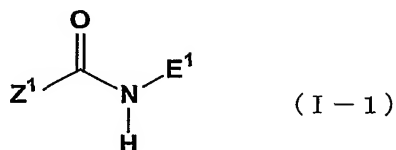
別の観点からは、本発明により、上記の（１）～（３８）の医薬の製造のための上記の各物質の使用が提供される。

また、本発明により、ヒトを含む哺乳類動物において NF- κ B 活性化を阻害する方法であって、上記（１）～（３８）の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与

する工程を含む方法；ヒトを含む哺乳類動物において上記物質群 δ より選択される 1 又は 2 以上の物質の遺伝子の発現を抑制する方法であって、上記 (1) ～ (38) の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法；ヒトを含む哺乳類動物において炎症性サイトカイン産生遊離を抑制する方法であって、上記 (1) ～ (38) の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法；ヒトを含む哺乳類動物において免疫を抑制する方法であって、上記 (1) ～ (38) の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法；上記疾患群 $\varepsilon - 1$ から選ばれる 1 又は 2 以上の疾患の予防及び／又は治療方法であって、上記 (1) ～ (38) の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法；及び、NF- κ B 活性化又は炎症性サイトカイン産生過剰に起因する上記疾患群 $\varepsilon - 2$ より選択される 1 又は 2 以上の疾患の予防及び／又は治療方法であって、上記 (1) ～ (38) の医薬をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法が提供される。

さらに、本発明により、

(1) 下記一般式 (I-1)：



(式中、

Z^1 は、5 位に置換基を有していてもよい 2-ヒドロキシフェニル基、又は 5 位に置換基を有していてもよい 2-アセトキシフェニル基を表し、

E^1 は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個で置換されたフェニル基（該フェニル基は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個の他にさらに置換基を有していてもよい）を表す）で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物（ただし、下記化合物を除く。

・N-〔3, 5-ビス（トリフルオロメチル）フェニル〕-2-ヒドロキシベンズアミド

・N-〔3, 5-ビス（トリフルオロメチル）フェニル〕-5-クロロ-2-ヒ

ドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-ブロモ-2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-ヨードベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-ニトロベンズアミド

・ 2-ヒドロキシ-N- [2, 3, 5-トリス (トリフルオロメチル) フェニル] ベンズアミド) が提供される。

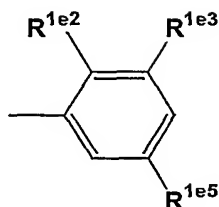
好適には、

(2) E¹が、1個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基2個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は、1個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基2個の他にさらに置換基を有していてもよい) である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(3) E¹が、3個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基2個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は、3個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基2個の他にさらに置換基を有していてもよい) である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(4) E¹が、3個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基2個で置換されたフェニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(5) E¹が、下記式：



(式中、

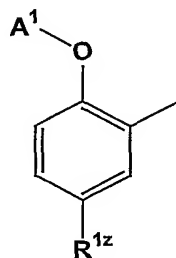
R^{1e2}及びR^{1e3}は、一方が水素原子、他方が3個以上のフッ素原子で置換されたC₁～C₆のアルキル基を表し、

R^{1e5}は、3個以上のフッ素原子で置換されたC₁～C₆のアルキル基を表す)である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(6) E¹が、3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、又は2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(7) E¹が、2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(8) Z¹が、下記式：



(式中、

A¹は、水素原子又はアセチル基を表し、

R^{1z}は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していても

よいアシル基、置換基を有していてもよいウレイド基、置換基を有していてもよいチオウレイド基、置換基を有していてもよいジアゼニル基を表す)である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(9) A^1 が、水素原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(10) R^{1z} が、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)ーアミノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基、置換基を有していてもよい5ないし6員のヘテロアリール基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキルカルボニル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基、置換基を有していてもよい5員のヘテロアリールスルホニル基、又は置換基を有していてもよいジアゼニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(11) R^{1z} が、ハロゲン原子、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、及び

(12) R^{1z} が、ハロゲン原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

最も好適には、下記化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

・N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-フルオロ-2-

ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-シアノ-2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5- (1, 1-ジメチル) エチル-2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- (トリフルオロメチル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- (1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- (2-フェニルエテン-1-イル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5- (2, 2-ジシアノエテン-1-イル) -2-ヒドロキシベンズアミド

・ 3- ({3- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル} -4-ヒドロキシフェニル) -2-シアノアクリル酸 メチルエステル

・ 3- ({3- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル} -4-ヒドロキシフェニル) -2-シアノアクリル酸

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-エチニル-2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- (フェニルエチニル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- [(トリメチルシリル) エチニル] ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -4-ヒドロキシビフェニル-3-カルボキサミド

- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (2-フェニルエチル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (3-チエニル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (1-ピロリル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (2-メチルチアゾール-4-イル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (2-ピリジル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-ジメチルアミノ
-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ベンゾイルアミノ-N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル]
-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N³- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -4-ヒドロキシ-
N¹, N¹-ジメチルイソフタルアミド
- ・ N¹, N³-ビス [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -4-ヒド
ロキシイソフタルアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (ピペリジーン-1-カルボニル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (4-ベンジルピペリジーン-1-カルボニル) ベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-ジメチルスルフ
アモイル-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-
- (ピロール-1-スルホニル) ベンズアミド
- ・ 5-アセチル-N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-

ヒドロキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-イソブチリルベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -4-ヒドロキシイソフタラミン酸 メチルエステル

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- [(4-ニトロフェニル) ジアゼニル] ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- ({[(4-ピリジン-2-イル) スルファモイル] フェニル } ジアゼニル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- [(3-フェニル) ウレイド] ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- [(3-フェニル) チオウレイド] ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- (1-ヒドロキシエチル) ベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5-メトキシベンズアミド

・ N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシ-5- [1- (メトキシイミノ) エチル] ベンズアミド

・ 5- { 1- [(ベンジルオキシ) イミノ] エチル } -N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [2, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-クロロ-2-ヒドロキシベンズアミド

・ N- [2, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] -5-ブromo-2-ヒドロキシベンズアミド

・ 2-アセトキシ-N- [3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル] ベン

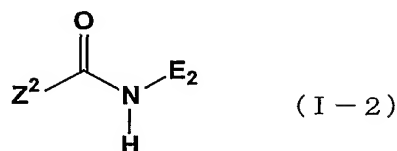
ズアミド

・ 2-アセトキシ-N-[2, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-クロロベンズアミド

・ 2-アセトキシ-N-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-クロロベンズアミド

さらに、本発明により、

(1) 下記一般式 (I-2) :



(式中、

Z^2 は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、

E^2 は、3位又は5位が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のハロゲン化アルキル基であるフェニル基(該フェニル基は、3位又は5位の $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のハロゲン化アルキル基の他に、さらに置換基を有していてもよい(ただし、該置換基が $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ のハロゲン化アルキル基である場合は除く))を表す)で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物又はそれらの溶媒和物(ただし、下記化合物を除く

・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・ 5-ブロモ-2-ヒドロキシ-N-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・ 2-ヒドロキシ-5-ヨード-N-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・ 5-クロロ-N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド

・ 5-クロロ-N-[5-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2

ーヒドロキシベンズアミド

・5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[4-ニトロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・5-フルオロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・5-フルオロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-(3-トリフルオロメチル-4-{[4-(トリフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ}フェニル)ベンズアミド

・N-[4-(ベンゾチアゾール-2-イル)スルファニル-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-クロロ-2-ヒドロキシベンズアミド

・5-クロロ-N-[2-(4-クロロフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド

・5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(4-メチルフェノキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・5-クロロ-N-[2-(4-クロロフェニル)スルファニル-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド

・5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(1-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド

・5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(2-ナフチルオキシ)-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド)が提供される。

好適には、

(2) E²が、3位又は5位が、1個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基であるフェニル基(該フェニル基は、3位又は5位の1個以上のフッ素原子で置換されたC₁~C₆のアルキル基の他に、さらに置換基を有していてもよい(ただし、該置換基がC₁~C₆のハロゲン化アルキル基である場合は除く))である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくは

はそれらの溶媒和物、

(3) E^2 が、3位又は5位が、3個以上のフッ素原子で置換された $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であるフェニル基（該フェニル基は、3位又は5位の3個以上のフッ素原子で置換された $C_1 \sim C_6$ のアルキル基の他に、さらに置換基を有していてもよい（ただし、該置換基が $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基である場合は除く））である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物

(4) E^2 が、3位又は5位が、3個以上のフッ素原子で置換された $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であるフェニル基（該フェニル基は、3位又は5位の3個以上のフッ素原子で置換された $C_1 \sim C_6$ のアルキル基の他に、下記置換基群 $\gamma - 7e$ より選択される基をさらに有していてもよい）である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

〔置換基群 $\gamma - 7e$ 〕ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい5ないし6員の非芳香族ヘテロ環基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキルスルファニル基

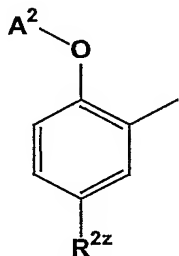
(5) E^2 が、3位又は5位がトリフルオロメチル基であるフェニル基（該フェニル基は、3位又は5位のトリフルオロメチル基の他に、下記置換基群 $\gamma - 7e$ より選択される基をさらに有していてもよい）である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

〔置換基群 $\gamma - 7e$ 〕ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい5ないし6員の非芳香族ヘテロ環基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキルスルファニル基

(6) E^2 が、3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-フルオロ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-フルオロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-クロロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、3-フルオロ

－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、３－ブromo－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－フルオロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－クロロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－ニトロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－シアノ－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－メチル－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－メチル－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－メチル－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－メトキシ－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、３－メトキシ－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、４－メトキシ－３－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－（メチルスルファニル）－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、２－（１－ピロリジノ）－５－（トリフルオロメチル）フェニル基、又は２－モルホリノ－５－（トリフルオロメチル）フェニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(7) Z^2 が、下記式：



(式中、

A^2 は、水素原子又はアセチル基を表し、

R^{2z} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、又は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を表す)である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(8) A^2 が、水素原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、及び

(9) R^{2z} が、ハロゲン原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、

又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

最も好適には、下記化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

- ・ 5-クロロ-N-[2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N-[2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 2-アセトキシ-5-クロロ-N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド
- ・ N-[2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N-[3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド

- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-ニトロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N-[4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 2-ヒドロキシ-5-メチル-N-[2-メチル-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[4-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 2-ヒドロキシ-5-メチル-N-[4-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-2-ヒドロキシ-N-[2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 2-ヒドロキシ-N-[2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-メチルベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-2-ヒドロキシ-N-[3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[4-メトキシ-3-(トリフルオロメチル)フェニル] ベンズアミド
- ・ 2-ヒドロキシ-N-[4-メトキシ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-メチルベンズアミド
- ・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-メチルスルファニル-5-(トリフ

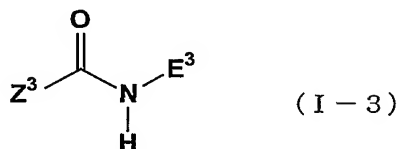
ルオロメチル) フェニル] ベンズアミド

・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-(1-ピロリジノ)-5-(トリフルオロメチル) フェニル] ベンズアミド

・ 5-クロロ-2-ヒドロキシ-N-[2-モルホリノ-5-(トリフルオロメチル) フェニル] ベンズアミド

さらに、本発明により、

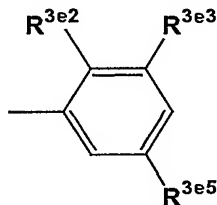
(1) 下記一般式 (I-3) :



(式中、

Z^3 は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、

E^3 は、下記式 :



(式中、

R^{3e2} 及び R^{3e3} は、同一又は異なって、水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヒドロキシ基を表し(ただし、 R^{3e2} 及び R^{3e3} が同時に水素原子である場合は除く)、

R^{3e5} は、置換基を有していてもよい $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ の炭化水素基を表す)で表される化合物若しくはその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

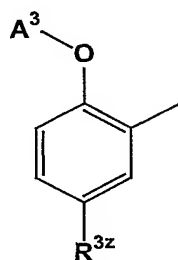
好適には、

(2) R^{3e2} 及び R^{3e3} が、同一又は異なって、水素原子、置換基を有していて

もよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、又は置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基であり（ただし、 R^{3e2} 及び R^{3e3} が同時に水素原子である場合は除く）、 R^{3e5} が、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルキル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(3) E^3 が、2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル基、又は5- (1, 1-ジメチル) エチルー2-メトキシフェニル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(4) Z^3 が、下記式：



(式中、

A^3 は、水素原子又はアセチル基を表し、

R^{3z} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、又は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を表す) である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(5) A^3 が、水素原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(6) R^{3z} が、ハロゲン原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

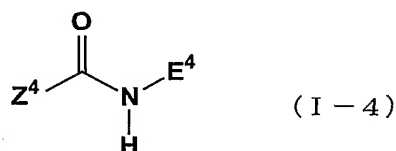
最も好適には、下記化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

・N- { 2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 5-クロロ-2-ヒドロキシベンズアミド

- ・ N- { 2, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド
- ・ N- { 3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 5-クロロ-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- { 3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 5-ブromo-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- { 3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド
- ・ 2-アセトキシ-N- { 3, 5-ビス [(1, 1-ジメチル) エチル] フェニル } - 5-クロロベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N- [5- (1, 1-ジメチル) エチル-2-メトキシフェニル] - 2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- [5- (1, 1-ジメチル) エチル-2-メトキシフェニル] - 2-ヒドロキシ-5-メチルベンズアミド
- ・ 2-アセトキシ-5-クロロ-N- [5- (1, 1-ジメチル) エチル-2-メトキシフェニル] ベンズアミド

さらに、本発明により、

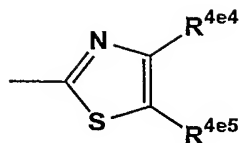
(1) 下記一般式 (I-4) :



(式中、

Z^4 は、5位に置換基を有していてもよい2-ヒドロキシフェニル基、又は5位に置換基を有していてもよい2-アセトキシフェニル基を表し、

E^4 は、下記式：



(式中、

R^{4e4} は、置換基を有していてもよい炭化水素基を表し、

R^{4e5} は、ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよいアシル基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表す) で表される化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

好適には、

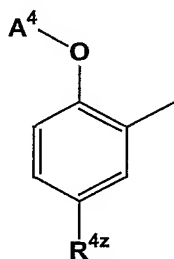
(2) R^{4e4} が、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基、又は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基であり、 R^{4e5} が、ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル-カルボニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール-カルボニル基、置換基を有していてもよい6員の非芳香族ヘテロ環基を表す) で表される化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(3) E^4 が、5-ブromo-4-[(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル基、5-ブromo-4-(トリフルオロメチル) チアゾール-2-イル基、5-シアノ-4-[(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル基、4-(1, 1-ジメチル) エチル-5-[(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル基、5-アセチル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、4-(1, 1-ジメチル) エチル-5-(エトキシカルボニル) チアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-(トリフルオロメチル) チアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニル-4-フェニルチアゾール-2-イル基、5-エトキシカルボニ

ルー 4- (ペンタフルオロフェニル) チアゾール-2-イル基、4- (1, 1-ジメチル) エチル-5-ピペリジノチアゾール-2-イル基、4- (1, 1-ジメチル) エチル-5-モルホリノチアゾール-2-イル基、4- (1, 1-ジメチル) エチル-5- (4-メチルピペリジン-1-イル) チアゾール-2-イル基、又は4- (1, 1-ジメチル) エチル-5- (4-フェニルピペリジン-1-イル) チアゾール-2-イル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(4) E⁴が、4- (1, 1-ジメチル) エチル-5- [(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル基である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(5) Z⁴が、下記式：



(式中、

A⁴は、水素原子又はアセチル基を表し、

R^{4z}は、ハロゲン原子、置換基を有していてもよいC₆~C₁₀のアリール基、又は5員のヘテロアリール基を表す) である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(6) A⁴が、水素原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物、

(7) R^{4z}が、ハロゲン原子である化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

最も好適には、下記化合物若しくは薬理学的に許容されるその塩、又はそれらの水和物若しくはそれらの溶媒和物が提供される。

- ・ 5-ブロモ-N- {5-ブロモ-4- [(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル} -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N- [5-ブロモ-4- (トリフルオロメチル) チアゾール-2-イル] -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N- {5-シアノ-4- [(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル} -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N- {5-シアノ-4- [(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-2-イル} -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-クロロ-N- {4- (1, 1-ジメチル) エチル-5- [(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル} -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 5-ブロモ-N- {4- (1, 1-ジメチル) エチル-5- [(2, 2-ジメチル) プロピオニル] チアゾール-2-イル} -2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- (5-アセチル-4-フェニルチアゾール-2-イル) -5-ブロモ-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ N- (5-ベンゾイル-4-フェニルチアゾール-2-イル) -5-ブロモ-2-ヒドロキシベンズアミド
- ・ 2- (5-ブロモ-2-ヒドロキシベンゾイル) アミノ-4- [(1, 1-ジメチル) エチル] チアゾール-5-カルボン酸 エチルエステル
- ・ 2- (5-ブロモ-2-ヒドロキシベンゾイル) アミノ-4- (トリフルオロメチル) チアゾール-5-カルボン酸 エチルエステル
- ・ 2- (5-クロロ-2-ヒドロキシベンゾイル) アミノ-4-フェニルチアゾール-5-カルボン酸 エチルエステル
- ・ 2- (5-ブロモ-2-ヒドロキシベンゾイル) アミノ-4-フェニルチアゾール-5-カルボン酸 エチルエステル
- ・ 2- [(4-ヒドロキシビフェニル) -3-カルボニル] アミノ-4-フェニルチアゾール-5-カルボン酸 エチルエステル
- ・ 2- [(4'-フルオロ-4-ヒドロキシビフェニル) -3-カルボニル] ア

- ミノー４－フェニルチアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
- ・ ２－〔（２′，４′－ジフルオロ－４－ヒドロキシビフェニル）－３－カルボニル〕アミノー４－フェニルチアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
 - ・ ２－〔〔４－ヒドロキシ－４′－（トリフルオロメチル）ビフェニル〕－３－カルボニル〕アミノー４－フェニルチアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
 - ・ ２－〔２－ヒドロキシ－５－（１－ピロリル）ベンゾイル〕アミノー４－フェニルチアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
 - ・ ２－〔２－ヒドロキシ－５－（１－チエニル）ベンゾイル〕アミノー４－フェニルチアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
 - ・ ２－（５－ブロモ－２－ヒドロキシベンゾイル）アミノー４－（ペンタフルオロフェニル）チアゾールー５－カルボン酸 エチルエステル
 - ・ ５－ブロモ－Ｎ－〔４－（１，１－ジメチル）エチル－５－ピペリジノチアゾールー２－イル〕－２－ヒドロキシベンズアミド
 - ・ ５－ブロモ－Ｎ－〔４－（１，１－ジメチル）エチル－５－モルホリノチアゾールー２－イル〕－２－ヒドロキシベンズアミド
 - ・ ５－ブロモ－Ｎ－〔４－（１，１－ジメチル）エチル－５－（４－メチルピペリジン－１－イル）チアゾールー２－イル〕－２－ヒドロキシベンズアミド
 - ・ ５－ブロモ－Ｎ－〔４－（１，１－ジメチル）エチル－５－（４－フェニルピペリジン－１－イル）チアゾールー２－イル〕－２－ヒドロキシベンズアミド

発明を実施するための最良の形態

本明細書において用いられる用語の意味は以下の通りである。

「ハロゲン原子」としては、特に言及する場合を除き、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子のいずれを用いてもよい。

「炭化水素基」としては、例えば、脂肪族炭化水素基、アリール基、アリーレン基、アラルキル基、架橋環式炭化水素基、スピロ環式炭化水素基、及びテルペ

ン系炭化水素等が挙げられる。

「脂肪族炭化水素基」としては、例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルキレン基、アルケニレン基、アルキリデン基等の直鎖状又は分枝鎖状の1価若しくは2価の非環式炭化水素基；シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカンジエニル基、シクロアルキルーアルキル基、シクロアルキレン基、シクロアルケニレン基等の飽和又は不飽和の1価若しくは2価の脂環式炭化水素基等が挙げられる。

「アルキル基」としては、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、1-メチルブチル、ネオペンチル、1, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、*n*-ヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、1-エチルブチル、1-エチルー1-メチルプロピル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル、*n*-ノニル、*n*-デシル、*n*-ウンデシル、*n*-ドデシル、*n*-トリデシル、*n*-テトラデシル、*n*-ペンタデシル等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基が挙げられる。

「アルケニル基」としては、例えば、ビニル、プロパー1-エン-1-イル、アリル、イソプロペニル、ブター1-エン-1-イル、ブター2-エン-1-イル、ブター3-エン-1-イル、2-メチルプロパー2-エン-1-イル、1-メチルプロパー2-エン-1-イル、ペンター1-エン-1-イル、ペンター2-エン-1-イル、ペンター3-エン-1-イル、ペンター4-エン-1-イル、3-メチルブター2-エン-1-イル、3-メチルブター3-エン-1-イル、ヘキサー1-エン-1-イル、ヘキサー2-エン-1-イル、ヘキサー3-エン-1-イル、ヘキサー4-エン-1-イル、ヘキサー5-エン-1-イル、4-メチルペンター3-エン-1-イル、4-メチルペンター3-エン-1-イル、

ヘプター 1-エン-1-イル、ヘプター 6-エン-1-イル、オクター 1-エン-1-イル、オクター 7-エン-1-イル、ノナー 1-エン-1-イル、ノナー 8-エン-1-イル、デカー 1-エン-1-イル、デカー 9-エン-1-イル、ウンデカー 1-エン-1-イル、ウンデカー 10-エン-1-イル、ドデカー 1-エン-1-イル、ドデカー 11-エン-1-イル、トリデカー 1-エン-1-イル、トリデカー 12-エン-1-イル、テトラデカー 1-エン-1-イル、テトラデカー 13-エン-1-イル、ペンタデカー 1-エン-1-イル、ペンタデカー 14-エン-1-イル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル基が挙げられる。

「アルキニル基」としては、例えば、エチニル、プロパー 1-イン-1-イル、プロパー 2-イン-1-イル、ブター 1-イン-1-イル、ブター 3-イン-1-イル、1-メチルプロパー 2-イン-1-イル、ペンター 1-イン-1-イル、ペンター 4-イン-1-イル、ヘキサ-1-イン-1-イル、ヘキサ-5-イン-1-イル、ヘプター 1-イン-1-イル、ヘプター 6-イン-1-イル、オクター 1-イン-1-イル、オクター 7-イン-1-イル、ノナー 1-イン-1-イル、ノナー 8-イン-1-イル、デカー 1-イン-1-イル、デカー 9-イン-1-イル、ウンデカー 1-イン-1-イル、ウンデカー 10-イン-1-イル、ドデカー 1-イン-1-イル、ドデカー 11-イン-1-イル、トリデカー 1-イン-1-イル、トリデカー 12-イン-1-イル、テトラデカー 1-イン-1-イル、テトラデカー 13-イン-1-イル、ペンタデカー 1-イン-1-イル、ペンタデカー 14-イン-1-イル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル基が挙げられる。

「アルキレン基」としては、例えば、メチレン、エチレン、エタン-1, 1-ジイル、プロパン-1, 3-ジイル、プロパン-1, 2-ジイル、プロパン-2, 2-ジイル、ブタン-1, 4-ジイル、ペンタン-1, 5-ジイル、ヘキサン-1, 6-ジイル、1, 1, 4, 4-テトラメチルブタン-1, 4-ジイル等の $C_1 \sim C_8$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基が挙げられる。

「アルケニレン基」としては、例えば、エテンー1，2-ジイル、プロペンー1，3-ジイル、ブター1-エン-1，4-ジイル、ブター2-エン-1，4-ジイル、2-メチルプロペン-1，3-ジイル、ペンター2-エン-1，5-ジイル、ヘキサ-3-エン-1，6-ジイル等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニレン基が挙げられる。

「アルキリデン基」としては、例えば、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、ペンチリデン、ヘキシリデン等の $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキリデン基が挙げられる。

「シクロアルキル基」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルキル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1，2，3，4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1，2，3，4-テトラヒドロナフタレン-2-イル等の基が挙げられる。

「シクロアルケニル基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1-イル、2-シクロブテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル、1-シクロブテン-1-イル、1-シクロペンテン-1-イル等の $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニル基が挙げられる。

なお、上記「シクロアルケニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インダニル、2-インダニル、1，2，3，4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1，2，3，4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルカンジエニル基」としては、例えば、2，4-シクロペンタンジエン-1-イル、2，4-シクロヘキサンジエン-1-イル、2，5-シクロヘキサンジエン-1-イル等の $C_5 \sim C_6$ のシクロアルカンジエニル基が挙げられ

る。

なお、上記「シクロアルカンジエニル基」は、ベンゼン環、ナフタレン環等と縮環していてもよく、例えば、1-インデニル、2-インデニル等の基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「シクロアルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、2-シクロプロピルエチル、3-シクロプロピルプロピル、4-シクロプロピルブチル、5-シクロプロピルペンチル、6-シクロプロピルヘキシル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘプチルメチル、シクロオクチルメチル、6-シクロオクチルヘキシル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル基が挙げられる。

「シクロアルキレン基」としては、例えば、シクロプロパン-1, 1-ジイル、シクロプロパン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 1-ジイル、シクロブタン-1, 2-ジイル、シクロブタン-1, 3-ジイル、シクロペンタン-1, 1-ジイル、シクロペンタン-1, 2-ジイル、シクロペンタン-1, 3-ジイル、シクロヘキサン-1, 1-ジイル、シクロヘキサン-1, 2-ジイル、シクロヘキサン-1, 3-ジイル、シクロヘキサン-1, 4-ジイル、シクロヘプタン-1, 1-ジイル、シクロヘプタン-1, 2-ジイル、シクロオクタン-1, 1-ジイル、シクロオクタン-1, 2-ジイル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキレン基が挙げられる。

「シクロアルケニレン基」としては、例えば、2-シクロプロペン-1, 1-ジイル、2-シクロブテン-1, 1-ジイル、2-シクロペンテン-1, 1-ジイル、3-シクロペンテン-1, 1-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 1-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 2-ジイル、2-シクロヘキセン-1, 4-ジイル、3-シクロヘキセン-1, 1-ジイル、1-シクロブテン-1, 2-ジイ

ル、1-シクロペンテン-1, 2-ジイル、1-シクロヘキセン-1, 2-ジイル等の $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニレン基が挙げられる。

「アリール基」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素基が挙げられ、例えば、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基が挙げられる。

なお、上記「アリール基」は、上記「 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基」、「 $C_3 \sim C_6$ のシクロアルケニル基」、又は「 $C_5 \sim C_6$ のシクロアルカンジエニル基」等と縮環していてもよく、例えば、4-インダニル、5-インダニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-5-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-6-イル、3-アセナフテニル、4-アセナフテニル、インデン-4-イル、インデン-5-イル、インデン-6-イル、インデン-7-イル、4-フェナレニル、5-フェナレニル、6-フェナレニル、7-フェナレニル、8-フェナレニル、9-フェナレニル等の基が挙げられる。

「アリーレン基」としては、例えば、1, 2-フェニレン、1, 3-フェニレン、1, 4-フェニレン、ナフタレン-1, 2-ジイル、ナフタレン-1, 3-ジイル、ナフタレン-1, 4-ジイル、ナフタレン-1, 5-ジイル、ナフタレン-1, 6-ジイル、ナフタレン-1, 7-ジイル、ナフタレン-1, 8-ジイル、ナフタレン-2, 3-ジイル、ナフタレン-2, 4-ジイル、ナフタレン-2, 5-ジイル、ナフタレン-2, 6-ジイル、ナフタレン-2, 7-ジイル、ナフタレン-2, 8-ジイル、アントラセン-1, 4-ジイル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリーレン基が挙げられる。

「アラルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が、「アリール基」で置換された基が挙げられ、例えば、ベンジル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル、アントラセニルメチル、フェナントレニルメチル、アセナフチレニルメチル、ジフェニルメチル、1-フェネチル、2-フェネチル、1-(1-ナフチル)エチル、1-(2-ナフチル)エチル、2-(1-ナフチル)エチル、2-(2-ナフチル)エチル、3-フェニルプロピル、3-(1-ナフチル)プ

ロピル、3-(2-ナフチル)プロピル、4-フェニルブチル、4-(1-ナフチル)ブチル、4-(2-ナフチル)ブチル、5-フェニルペンチル、5-(1-ナフチル)ペンチル、5-(2-ナフチル)ペンチル、6-フェニルヘキシル、6-(1-ナフチル)ヘキシル、6-(2-ナフチル)ヘキシル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基が挙げられる。

「架橋環式炭化水素基」としては、例えば、ビスクロ〔2. 1. 0〕ペンチル、ビスクロ〔2. 2. 1〕ヘプチル、ビスクロ〔2. 2. 1〕オクチル、アダマンチル等の基が挙げられる。

「スピロ環式炭化水素基」、としては、例えば、スピロ〔3. 4〕オクチル、スピロ〔4. 5〕デカー1, 6-ジエニル等の基が挙げられる。

「テルペン系炭化水素」としては、例えば、ゲラニル、ネリル、リナリル、フィチル、メンチル、ボルニル等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキル基」としては、「アルキル基」の1つの水素原子が「ハロゲン原子」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、トリブロモメチル、ヨードメチル、ジヨードメチル、トリヨードメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、ノナフルオロブチル、パーフルオロヘキシル等の1ないし13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル基が挙げられる。

「ヘテロ環基」としては、例えば、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式ヘテロアリアル基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「単環式ヘテロアリアル基」としては、例えば、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-オキサジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-オキサジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-2-イル、(1, 3, 4-オキサジアゾール)-5-イル、フラザニル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-4-イル、(1, 2, 3-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 4-チアジアゾール)-5-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-3-イル、(1, 2, 5-チアジアゾール)-4-イル、(1, 3, 4-チアジアゾリル)-2-イル、(1, 3, 4-チアジアゾリル)-5-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-1-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-4-イル、(1H-1, 2, 3-トリアゾール)-5-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール)-2-イル、(2H-1, 2, 3-トリアゾール)-4-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール)-1-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール)-3-イル、(1H-1, 2, 4-トリアゾール)-5-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール)-3-イル、(4H-1, 2, 4-トリアゾール)-4-イル、(1H-テトラゾール)-1-イル、(1H-テトラゾール)-5-イル、(2H-テトラゾール)-2-イル、(2H-テトラゾール)-5-イル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、(1, 2, 3-トリアジン)

-4-イル、(1, 2, 3-トリアジン) -5-イル、(1, 2, 4-トリアジン)
 -3-イル、(1, 2, 4-トリアジン) -5-イル、(1, 2, 4-トリアジン)
 -6-イル、(1, 3, 5-トリアジン) -2-イル、1-アゼピニル、1-ア
 ゼピニル、2-アゼピニル、3-アゼピニル、4-アゼピニル、(1, 4-オキ
 サゼピン) -2-イル、(1, 4-オキサゼピン) -3-イル、(1, 4-オキサ
 ゼピン) -5-イル、(1, 4-オキサゼピン) -6-イル、(1, 4-オキサゼ
 ピン) -7-イル、(1, 4-チアゼピン) -2-イル、(1, 4-チアゼピン)
 -3-イル、(1, 4-チアゼピン) -5-イル、(1, 4-チアゼピン) -6-
 イル、(1, 4-チアゼピン) -7-イル等の5ないし7員の単環式ヘテロアリ
 ール基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール基」としては、例えば、2-ベンゾフラニル、3-
 ベンゾフラニル、4-ベンゾフラニル、5-ベンゾフラニル、6-ベンゾフラ
 ニル、7-ベンゾフラニル、1-イソベンゾフラニル、4-イソベンゾフラニル、
 5-イソベンゾフラニル、2-ベンゾ [b] チエニル、3-ベンゾ [b] チエニ
 ル、4-ベンゾ [b] チエニル、5-ベンゾ [b] チエニル、6-ベンゾ [b]
 チエニル、7-ベンゾ [b] チエニル、1-ベンゾ [c] チエニル、4-ベンゾ
 [c] チエニル、5-ベンゾ [c] チエニル、1-インドリル、1-インドリル、
 2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-イン
 ドリル、7-インドリル、(2H-イソインドール) -1-イル、(2H-イソイ
 ンドール) -2-イル、(2H-イソインドール) -4-イル、(2H-イソイン
 ドール) -5-イル、(1H-インダゾール) -1-イル、(1H-インダゾール)
 -3-イル、(1H-インダゾール) -4-イル、(1H-インダゾール) -5-
 イル、(1H-インダゾール) -6-イル、(1H-インダゾール) -7-イル、
 (2H-インダゾール) -1-イル、(2H-インダゾール) -2-イル、(2H-
 インダゾール) -4-イル、(2H-インダゾール) -5-イル、2-ベンゾ
 オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、4-ベンゾオキサゾリル、5-ベンゾ
 オキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、7-ベンゾオキサゾリル、(1, 2-

ベンゾイソオキサゾール) - 3-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール) - 4-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール) - 5-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール) - 6-イル、(1, 2-ベンゾイソオキサゾール) - 7-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール) - 3-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール) - 4-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール) - 5-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール) - 6-イル、(2, 1-ベンゾイソオキサゾール) - 7-イル、2-ベンゾチアゾリル、4-ベンゾチアゾリル、5-ベンゾチアゾリル、6-ベンゾチアゾリル、7-ベンゾチアゾリル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール) - 3-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール) - 4-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール) - 5-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール) - 6-イル、(1, 2-ベンゾイソチアゾール) - 7-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール) - 3-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール) - 4-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール) - 5-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール) - 6-イル、(2, 1-ベンゾイソチアゾール) - 7-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 4-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 6-イル、(1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 7-イル、(2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 4-イル、(2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 4-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 5-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 6-イル、(1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール) - 7-イル、(2, 1, 3-ベンゾチアジアゾール) - 4-イル、(2, 1, 3-ベンゾチアジアゾール) - 5-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 1-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 4-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 5-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 6-イル、(1H-ベンゾトリアゾール) - 7-イル、(2H-ベンゾトリアゾール) - 2-イル、(2H-ベンゾトリアゾール) - 4-イル、(2H-ベンゾトリアゾール) - 5-イル、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノ

リル、7-キノリル、8-キノリル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル、3-シンノリニル、4-シンノリニル、5-シンノリニル、6-シンノリニル、7-シンノリニル、8-シンノリニル、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、5-キナゾリニル、6-キナゾリニル、7-キナゾリニル、8-キナゾリニル、2-キノキサリニル、5-キノキサリニル、6-キノキサリニル、1-フタラジニル、5-フタラジニル、6-フタラジニル、2-ナフチリジニル、3-ナフチリジニル、4-ナフチリジニル、2-プリニル、6-プリニル、7-プリニル、8-プリニル、2-プテリジニル、4-プテリジニル、6-プテリジニル、7-プテリジニル、1-カルバゾリル、2-カルバゾリル、3-カルバゾリル、4-カルバゾリル、9-カルバゾリル、2-(α -カルボリニル)、3-(α -カルボリニル)、4-(α -カルボリニル)、5-(α -カルボリニル)、6-(α -カルボリニル)、7-(α -カルボリニル)、8-(α -カルボリニル)、9-(α -カルボリニル)、1-(β -カルボニリル)、3-(β -カルボニリル)、4-(β -カルボニリル)、5-(β -カルボニリル)、6-(β -カルボニリル)、7-(β -カルボニリル)、8-(β -カルボニリル)、9-(β -カルボニリル)、1-(γ -カルボリニル)、2-(γ -カルボリニル)、4-(γ -カルボリニル)、5-(γ -カルボリニル)、6-(γ -カルボリニル)、7-(γ -カルボリニル)、8-(γ -カルボリニル)、9-(γ -カルボリニル)、1-アクリジニル、2-アクリジニル、3-アクリジニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル、1-フェノキサジニル、2-フェノキサジニル、3-フェノキサジニル、4-フェノキサジニル、10-フェノキサジニル、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニル、4-フェノチアジニル、10-フェノチアジニル、1-フェナジニル、2-フェナジニル、1-フェナントリジニル、2-フェナントリジニル、3-フェナントリジニル、4-フェナントリジニル、6-フェナントリジニル、7-フェナントリジニル、8-フェナントリジニル、9-フェナントリジニル、10-フェナントリジニル、2-フェナントロリニル、3-フ

エナントロリニル、4-フェナントロリニル、5-フェナントロリニル、6-フェナントロリニル、7-フェナントロリニル、8-フェナントロリニル、9-フェナントロリニル、10-フェナントロリニル、1-チアントレニル、2-チアントレニル、1-インドリジニル、2-インドリジニル、3-インドリジニル、5-インドリジニル、6-インドリジニル、7-インドリジニル、8-インドリジニル、1-フェノキサチイニル、2-フェノキサチイニル、3-フェノキサチイニル、4-フェノキサチイニル、チエノ〔2, 3-b〕フリル、ピロロ〔1, 2-b〕ピリダジニル、ピラゾロ〔1, 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 5-a〕ピリジル、イミダゾ〔1, 2-b〕ピリダジニル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリミジニル、1, 2, 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジル、1, 2, 4-トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリダジニル等の8ないし14員の縮合多環式ヘテロアリール基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、1-アジリジニル、1-アゼチジニル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、2-テトラヒドロフリル、3-テトラヒドロフリル、チオラニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、1-(2-ピロリニル)、1-(2-イミダゾリニル)、2-(2-イミダゾリニル)、1-(2-ピラゾリニル)、3-(2-ピラゾリニル)、ピペリジノ、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1-ホモピペリジニル、2-テトラヒドロピラニル、モルホリノ、(チオモルホリン)-4-イル、1-ピペラジニル、1-ホモピペラジニル等の3ないし7員の飽和若しくは不飽和の単環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環基」としては、例えば、2-キヌクリジニル、2-クロマニル、3-クロマニル、4-クロマニル、5-クロマニル、6-クロマニル、7-クロマニル、8-クロマニル、1-イソクロマニル、3-イソクロマニル、4-イソクロマニル、5-イソクロマニル、6-イソクロマニル、7-

イソクロマニル、8-イソクロマニル、2-チオクロマニル、3-チオクロマニル、4-チオクロマニル、5-チオクロマニル、6-チオクロマニル、7-チオクロマニル、8-チオクロマニル、1-イソチオクロマニル、3-イソチオクロマニル、4-イソチオクロマニル、5-イソチオクロマニル、6-イソチオクロマニル、7-イソチオクロマニル、8-イソチオクロマニル、1-インドリニル、2-インドリニル、3-インドリニル、4-インドリニル、5-インドリニル、6-インドリニル、7-インドリニル、1-イソインドリニル、2-イソインドリニル、4-イソインドリニル、5-イソインドリニル、2-(4H-クロメニル)、3-(4H-クロメニル)、4-(4H-クロメニル)、5-(4H-クロメニル)、6-(4H-クロメニル)、7-(4H-クロメニル)、8-(4H-クロメニル)、1-イソクロメニル、3-イソクロメニル、4-イソクロメニル、5-イソクロメニル、6-イソクロメニル、7-イソクロメニル、8-イソクロメニル、1-(1H-ピロリジニル)、2-(1H-ピロリジニル)、3-(1H-ピロリジニル)、5-(1H-ピロリジニル)、6-(1H-ピロリジニル)、7-(1H-ピロリジニル)等の8ないし10員の飽和若しくは不飽和の縮合多環式非芳香族ヘテロ環基が挙げられる。

上記「ヘテロ環基」の中で、環系を構成する原子（環原子）として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を有していてもよい単環式又は縮合多環式ヘテロアリアル基、並びに、環系を構成する原子（環原子）として、結合手を有する窒素原子の他に、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を有していてもよい単環式又は縮合多環式非芳香族ヘテロ環基を「環状アミノ基」と称し、例えば、1-ピロリジニル、1-イミダゾリジニル、1-ピラゾリジニル、1-オキサゾリジニル、1-チアゾリジニル、ピペリジノ、モルホリノ、1-ピペラジニル、チオモルホリン-4-イル、1-ホモピペリジニル、1-ホモピペラジニル、2-ピロリン-1-イル、2-イミダゾリン-1-イル、2-ピラゾリン-1-イル、1-インドリニル、2-イソインドリニル、1, 2, 3,

4-テトラヒドロキノリン-1-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル、1-ピロリル、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-インドリル、1-インダゾリル、2-イソインドリル等の基が挙げられる。

「炭化水素-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-オキシ基」としては、例えば、アルコキシ基（アルキル-オキシ基）、アルケニル-オキシ基、アルキニル-オキシ基、シクロアルキル-オキシ基、シクロアルキル-アルキル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-オキシ基；アリール-オキシ基；アラルキル-オキシ基；アルキレン-ジ-オキシ基等が挙げられる。

「アルコキシ基（アルキル-オキシ基）」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシ、*n*-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、2-メチルブトキシ、1-メチルブトキシ、ネオペンチルオキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、*n*-ヘキシルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、1-メチルペンチルオキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1-エチルブトキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、*n*-ヘプチルオキシ、*n*-オクチルオキシ、*n*-ノニルオキシ、*n*-デシルオキシ、*n*-ウンデシルオキシ、*n*-ドデシルオキシ、*n*-トリデシルオキシ、*n*-テトラデシルオキシ、*n*-ペンタデシルオキシ等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のアルコキシ基が挙げられる。

「アルケニル-オキシ基」としては、例えば、ビニルオキシ、(プロパー-1-エン-1-イル)オキシ、アリルオキシ、イソプロペニルオキシ、(ブター-1-エン-1-イル)オキシ、(ブター-2-エン-1-イル)オキシ、(ブター-3-エン-1-イル)オキシ、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル)オキシ、(1

ーメチルプロパー 2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター 1-エン-1-イル) オキシ、(ペンター 2-エン-1-イル) オキシ、(ペンター 3-エン-1-イル) オキシ、(ペンター 4-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター 2-エン-1-イル) オキシ、(3-メチルブター 3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 1-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 2-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 3-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 4-エン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 5-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター 3-エン-1-イル) オキシ、(4-メチルペンター 3-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター 1-エン-1-イル) オキシ、(ヘプター 6-エン-1-イル) オキシ、(オクター 1-エン-1-イル) オキシ、(オクター 7-エン-1-イル) オキシ、(ノナー 1-エン-1-イル) オキシ、(ノナー 8-エン-1-イル) オキシ、(デカー 1-エン-1-イル) オキシ、(デカー 9-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー 1-エン-1-イル) オキシ、(ウンデカー 10-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー 1-エン-1-イル) オキシ、(ドデカー 11-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー 1-エン-1-イル) オキシ、(トリデカー 12-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー 1-エン-1-イル) オキシ、(テトラデカー 13-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー 1-エン-1-イル) オキシ、(ペンタデカー 14-エン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-オキシ基が挙げられる。

「アルキニル-オキシ基」としては、例えば、エチニルオキシ、(プロパー 1-イン-1-イル) オキシ、(プロパー 2-イン-1-イル) オキシ、(ブター 1-イン-1-イル) オキシ、(ブター 3-イン-1-イル) オキシ、(1-メチルプロパー 2-イン-1-イル) オキシ、(ペンター 1-イン-1-イル) オキシ、(ペンター 4-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 1-イン-1-イル) オキシ、(ヘキサー 5-イン-1-イル) オキシ、(ヘプター 1-イン-1-イル) オキシ、(ヘプター 6-イン-1-イル) オキシ、(オクター 1-イン-1-イル) オキシ、(オクター 7-イン-1-イル) オキシ、(ノナー 1-イン-1-イル)

オキシ、(ノナ-8-イン-1-イル) オキシ、(デカ-1-イン-1-イル) オキシ、(デカ-9-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(ウンデカ-10-イン-1-イル) オキシ、(ドデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(トリデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(トリデカ-12-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(テトラデカ-13-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) オキシ、(ペンタデカ-14-イン-1-イル) オキシ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘプチルオキシ、シクロオクチルオキシ等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-オキシ基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-オキシ基」としては、例えば、シクロプロピルメトキシ、1-シクロプロピルエトキシ、2-シクロプロピルエトキシ、3-シクロプロピルプロポキシ、4-シクロプロピルブトキシ、5-シクロプロピルペンチルオキシ、6-シクロプロピルヘキシルオキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロヘキシルメトキシ、2-シクロヘキシルエトキシ、3-シクロヘキシルプロポキシ、4-シクロヘキシルブトキシ、シクロヘプチルメトキシ、シクロオクチルメトキシ、6-シクロオクチルヘキシルオキシ等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル-オキシ基が挙げられる。

「アリール-オキシ基」としては、例えば、フェノキシ、1-ナフチルオキシ、2-ナフチルオキシ、アントリルオキシ、フェナントリルオキシ、アセナフチレニルオキシ等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール-オキシ基が挙げられる。

「アラルキル-オキシ基」としては、例えば、ベンジルオキシ、1-ナフチルメトキシ、2-ナフチルメトキシ、アントラセニルメトキシ、フェナントレニル

メトキシ、アセナフチレニルメトキシ、ジフェニルメトキシ、1-フェネチルオキシ、2-フェネチルオキシ、1-(1-ナフチル)エトキシ、1-(2-ナフチル)エトキシ、2-(1-ナフチル)エトキシ、2-(2-ナフチル)エトキシ、3-フェニルプロポキシ、3-(1-ナフチル)プロポキシ、3-(2-ナフチル)プロポキシ、4-フェニルブトキシ、4-(1-ナフチル)ブトキシ、4-(2-ナフチル)ブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、5-(1-ナフチル)ペンチルオキシ、5-(2-ナフチル)ペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシ、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシ等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキルーオキシ基が挙げられる。

「アルキレンジオキシ基」としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、1-メチルメチレンジオキシ、1, 1-ジメチルメチレンジオキシ等の基が挙げられる。

「ハロゲン化アルコキシ基 (ハロゲン化アルキルーオキシ基)」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロイソプロポキシ、ノナフルオロブトキシ、パーフルオロヘキシルオキシ等の1ないし13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルコキシ基が挙げられる。

「ヘテロ環-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーオキシ基、縮合多環式ヘテロアリールーオキシ基、単環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基等が挙げられる。

「単環式ヘテロアリールーオキシ基」としては、例えば、3-チエニルオキシ、

(イソキサゾール-3-イル) オキシ、(チアゾール-4-イル) オキシ、2-ピリジルオキシ、3-ピリジルオキシ、4-ピリジルオキシ、(ピリミジン-4-イル) オキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール-オキシ基」としては、5-インドリルオキシ、(ベンズイミダゾール-2-イル) オキシ、2-キノリルオキシ、3-キノリルオキシ、4-キノリルオキシ等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、3-ピロリジニルオキシ、4-ピペリジニルオキシ等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環-オキシ基」としては、例えば、3-インドリニルオキシ、4-クロマニルオキシ等の基が挙げられる。

「炭化水素-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。「炭化水素-スルファニル基」としては、例えば、アルキル-スルファニル基、アルケニル-スルファニル基、アルキニル-スルファニル基、シクロアルキル-スルファニル基、シクロアルキル-アルキル-スルファニル基等の脂肪族炭化水素-スルファニル基；アリール-スルファニル基、アラルキル-スルファニル基等が挙げられる。

「アルキル-スルファニル基」としては、例えば、メチルスルファニル、エチルスルファニル、*n*-プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、*n*-ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル、*sec*-ブチルスルファニル、*tert*-ブチルスルファニル、*n*-ペンチルスルファニル、イソペンチルスルファニル、(2-メチルブチル) スルファニル、(1-メチルブチル) スルファニル、ネオペンチルスルファニル、(1, 2-ジメチルプロピル) スルファニル、(1-エチルプロピル) スルファニル、*n*-ヘキシルスルファニル、(4-メチルペンチル) スルファニル、(3-メチルペンチル) スルファニル、(2-メチルペンチル) スルファニル、(1-メチルペンチル) スルファニル、(3, 3-ジメチルブチル) スルファニル、(2, 2-ジメチルブチル) スルファニル、(1, 1-ジ

メチルブチル) スルファニル、(1, 2-ジメチルブチル) スルファニル、(1, 3-ジメチルブチル) スルファニル、(2, 3-ジメチルブチル) スルファニル、(2-エチルブチル) スルファニル、(1-エチルブチル) スルファニル、(1-エチル-1-メチルプロピル) スルファニル、n-ヘプチルスルファニル、n-オクチルスルファニル、n-ノニルスルファニル、n-デシルスルファニル、n-ウンデシルスルファニル、n-ドデシルスルファニル、n-トリデシルスルファニル、n-テトラデシルスルファニル、n-ペンタデシルスルファニル等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のアルキルスルファニル基が挙げられる。

「アルケニルスルファニル基」としては、例えば、ビニルスルファニル、(プロパー-1-エン-1-イル) スルファニル、アリルスルファニル、イソプロペニルスルファニル、(ブター-1-エン-1-イル) スルファニル、(ブター-2-エン-1-イル) スルファニル、(ブター-3-エン-1-イル) スルファニル、(2-メチルプロパー-2-エン-1-イル) スルファニル、(1-メチルプロパー-2-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-1-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-2-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ペンター-4-エン-1-イル) スルファニル、(3-メチルブター-2-エン-1-イル) スルファニル、(3-メチルブター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー-1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー-2-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー-4-エン-1-イル) スルファニル、(ヘキサー-5-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(4-メチルペンター-3-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター-1-エン-1-イル) スルファニル、(ヘプター-6-エン-1-イル) スルファニル、(オクター-1-エン-1-イル) スルファニル、(オクター-7-エン-1-イル) スルファニル、(ノナ-1-エン-1-イル) スルファニル、(ノナ-8-エン-1-イル) スルファニル、(デカー-1-エン-1-イル) スルファニル、(デカー-9-エン-1-イル) スルファニル、(ウンデカー-1-エン-1-イル) スルファニル、(ウ

ンデカー 10-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 11-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 12-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 13-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 1-エン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 14-エン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルケニル-スルファニル基が挙げられる。

「アルキニル-スルファニル基」としては、例えば、エチニルスルファニル、(プロパー 1-イン-1-イル) スルファニル、(プロパー 2-イン-1-イル) スルファニル、(ブター 1-イン-1-イル) スルファニル、(ブター 3-イン-1-イル) スルファニル、(1-メチルプロパー 2-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター 1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンター 4-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ヘキサ-5-イン-1-イル) スルファニル、(ヘプター 1-イン-1-イル、(ヘプター 6-イン-1-イル) スルファニル、(オクター 1-イン-1-イル) スルファニル、(オクター 7-イン-1-イル) スルファニル、(ノナ-1-イン-1-イル) スルファニル、(ノナ-8-イン-1-イル) スルファニル、(デカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(デカー 9-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(ウンデカー 10-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(ドデカー 11-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(トリデカー 12-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(テトラデカー 13-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 1-イン-1-イル) スルファニル、(ペンタデカー 14-イン-1-イル) スルファニル等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のアルキニル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-スルファニル基」としては、例えば、シクロプロピルスル

ファニル、シクロブチルスルファニル、シクロペンチルスルファニル、シクロヘキシルスルファニル、シクロヘプチルスルファニル、シクロオクチルスルファニル等の $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル-スルファニル基が挙げられる。

「シクロアルキル-アルキル-スルファニル基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) スルファニル、(1-シクロプロピルエチル) スルファニル、(2-シクロプロピルエチル) スルファニル、(3-シクロプロピルプロピル) スルファニル、(4-シクロプロピルブチル) スルファニル、(5-シクロプロピルペンチル) スルファニル、(6-シクロプロピルヘキシル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロブチルメチル) スルファニル、(シクロペンチルメチル) スルファニル、(シクロヘキシルメチル) スルファニル、(2-シクロヘキシルエチル) スルファニル、(3-シクロヘキシルプロピル) スルファニル、(4-シクロヘキシルブチル) スルファニル、(シクロヘプチルメチル) スルファニル、(シクロオクチルメチル) スルファニル、(6-シクロオクチルヘキシル) スルファニル等の $C_4 \sim C_{14}$ のシクロアルキル-アルキル-スルファニル基が挙げられる。

「アリール-スルファニル基」としては、例えば、フェニルスルファニル、1-ナフチルスルファニル、2-ナフチルスルファニル、アントリルスルファニル、フェナントリルスルファニル、アセナフチレニルスルファニル等の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール-スルファニル基が挙げられる。

「アラルキル-スルファニル基」としては、例えば、ベンジルスルファニル、(1-ナフチルメチル) スルファニル、(2-ナフチルメチル) スルファニル、(アントラセニルメチル) スルファニル、(フェナントレニルメチル) スルファニル、(アセナフチレニルメチル) スルファニル、(ジフェニルメチル) スルファニル、(1-フェネチル) スルファニル、(2-フェネチル) スルファニル、(1-(1-ナフチル) エチル) スルファニル、(1-(2-ナフチル) エチル) スルファニル、(2-(1-ナフチル) エチル) スルファニル、(2-(2-ナフチル) エチル) スルファニル、(3-フェニルプロピル) スルファニル、(3-(1-ナフ

チル) プロピル) スルファニル、(3-(2-ナフチル) プロピル) スルファニル、(4-フェニルブチル) スルファニル、(4-(1-ナフチル) ブチル) スルファニル、(4-(2-ナフチル) ブチル) スルファニル、(5-フェニルペンチル) スルファニル、(5-(1-ナフチル) ペンチル) スルファニル、(5-(2-ナフチル) ペンチル) スルファニル、(6-フェニルヘキシル) スルファニル、(6-(1-ナフチル) ヘキシル) スルファニル、(6-(2-ナフチル) ヘキシル) スルファニル等の $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル-スルファニル基が挙げられる。

「ハロゲン化アルキル-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「ハロゲン化アルキル基」で置換された基が挙げられ、例えば、(フルオロメチル) スルファニル、(クロロメチル) スルファニル、(ブロモメチル) スルファニル、(ヨードメチル) スルファニル、(ジフルオロメチル) スルファニル、(トリフルオロメチル) スルファニル、(トリクロロメチル) スルファニル、(2, 2, 2-トリフルオロエチル) スルファニル、(ペンタフルオロエチル) スルファニル、(3, 3, 3-トリフルオロプロピル) スルファニル、(ヘプタフルオロプロピル) スルファニル、(ヘプタフルオロイソプロピル) スルファニル、(ノナフルオロブチル) スルファニル、(パーフルオロヘキシル) スルファニル等の1ないし13個のハロゲン原子で置換された $C_1 \sim C_6$ の直鎖状又は分枝鎖状のハロゲン化アルキル-スルファニル基が挙げられる。

「ヘテロ環-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。「ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-スルファニル基、縮合多環式ヘテロアリール-スルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基等が挙げられる。

「単環式ヘテロアリール-スルファニル基」としては、例えば、(イミダゾール-2-イル) スルファニル、(1, 2, 4-トリアゾール-2-イル) スルファニル、(ピリジン-2-イル) スルファニル、(ピリジン-4-イル) スルファニル

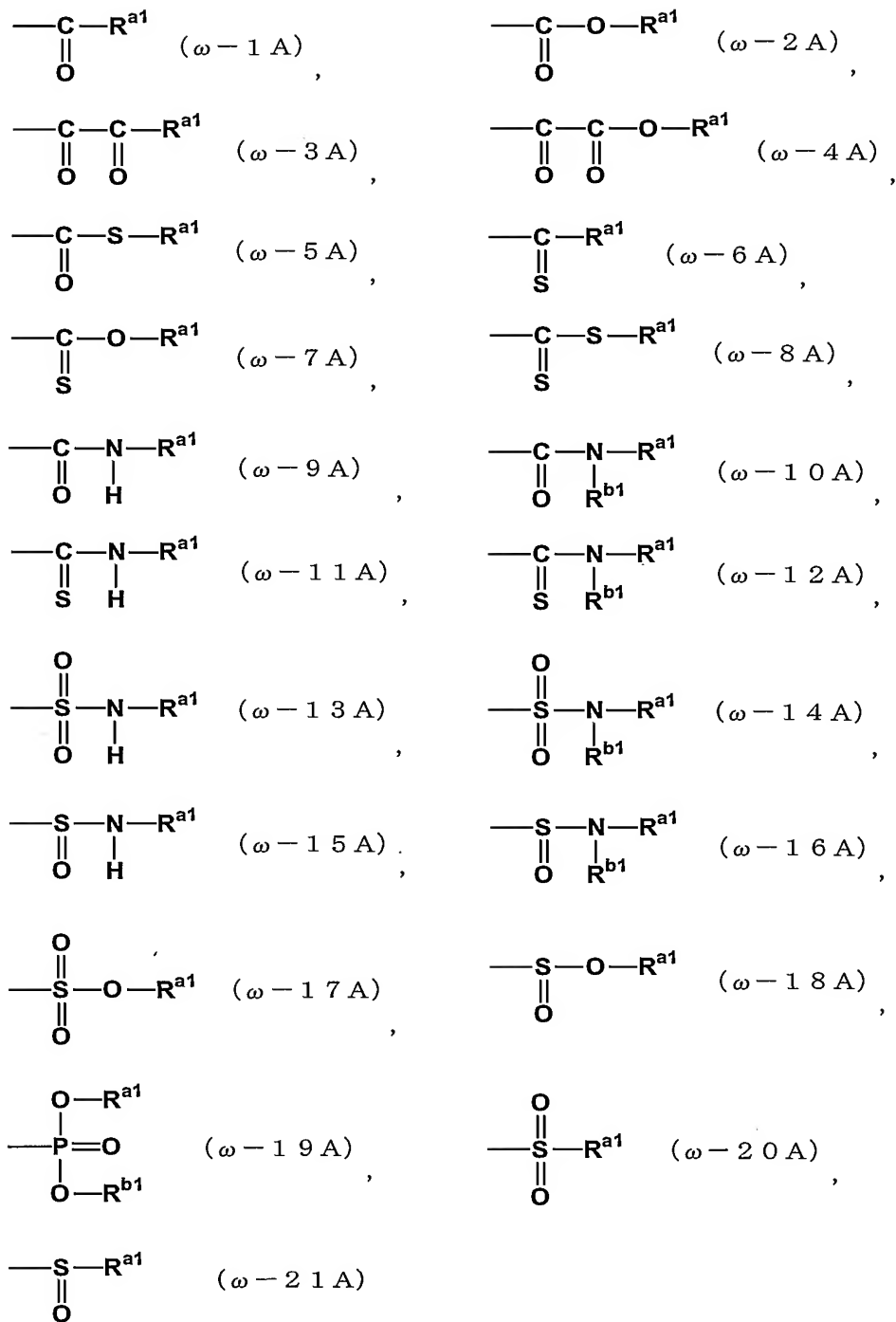
ニル、(ピリミジン-2-イル) スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式ヘテロアリール-スルファニル基」としては、(ベンズイミダゾール-2-イル) スルファニル、(キノリン-2-イル) スルファニル、(キノリン-4-イル) スルファニル等の基が挙げられる。

「単環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、(3-ピロリジニル) スルファニル、(4-ピペリジニル) スルファニル等の基が挙げられる。

「縮合多環式非芳香族ヘテロ環-スルファニル基」としては、例えば、(3-インドリニル) スルファニル、(4-クロマニル) スルファニル等の基が挙げられる。

「アシル基」としては、例えば、ホルミル基、グリオキシロイル基、チオホルミル基、及び下記式：



(式中、 R^{a1} 及び R^{b1} は、同一又は異なって、炭化水素基又はヘテロ環基を表すか、或いは R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシル基」の定義において、

式 (ω-1 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル基」(具体例: アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ラウロイル、ミリストイル、パルミトイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、イソクロトノイル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘキシルメチルカルボニル、ベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイル、フェニルアセチル等の基)、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル基」(具体例: 2-テノイル、3-フロイル、ニコチノイル、イソニコチノイル等の基) と称する。

式 (ω-2 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル基」(具体例: メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、フェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル等の基)、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル基」(具体例: 3-ピリジルオキシカルボニル等の基) と称する。

式 (ω-3 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-カルボニル-カルボニル基」(具体例: ピルボイル等の基)、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-カルボニル-カルボニル基」と称する。

式 (ω-4 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシカルボニル-カルボニル基」(具体例: メトキサリル、エトキサリル等の基)、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシカルボニル-カルボニル基」と称する。

式 (ω-5 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-スルファニル-カルボニル基」、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルファニル-カルボニル基」と称する。

式 (ω-6 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-チオカルボニル基」、R^{a1}がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-チオカルボニル基」と称する。

式 (ω-7 A) で表される基の中で、R^{a1}が炭化水素基である基を「炭化水素-

オキシチオカルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシチオカルボニル基」と称する。

式(ω-8A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルチオカルボニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルチオカルボニル基」と称する。

式(ω-9A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーカルバモイル基」(具体例：Nーメチルカルバモイル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ーカルバモイル基」と称する。

式(ω-10A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, Nージ(炭化水素)ーカルバモイル基」(具体例：N, Nージメチルカルバモイル等の基)、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, Nージ(ヘテロ環)ーカルバモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「Nー炭化水素ーNーヘテロ環ー置換カルバモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーカルボニル基」(具体例：モルホリノカルボニル等の基)と称する。

式(ω-11A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーチオカルバモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ーチオカルバモイル基」と称する。

式(ω-12A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, Nージ(炭化水素)ーチオカルバモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, Nージ(ヘテロ環)ーチオカルバモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「Nー炭化水素ーNーヘテロ環ーチオカルバモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノーチオカルボニル基」と称する。

式(ω-13A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ースルファモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ースルファモイル基」と称する。

式(ω-14A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)－スルファモイル基」(具体例：N, N-ジメチルスルファモイル等の基)、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)スルファモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環－スルファモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルホニル基」(具体例：1-ピロリルスルホニル等の基)と称する。

式(ω-15A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「N-炭化水素－スルフィナモイル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環－スルフィナモイル基」と称する。

式(ω-16A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)－スルフィナモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)－スルフィナモイル基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環－スルフィナモイル基」、 R^{a1} 及び R^{b1} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノースルフィニル基」と称する。

式(ω-17A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素－オキシースルホニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環－オキシースルホニル基」と称する。

式(ω-18A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素－オキシースルフィニル基」、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環－オキシースルフィニル基」と称する。

式(ω-19A)で表される基の中で、 R^{a1} 及び R^{b1} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ(炭化水素)－ホスホノ基」、 R^{a1} 及び R^{b1} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ(ヘテロ環)－ホスホノ基」、 R^{a1} が炭化水素基であり R^{b1} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環－ホスホノ基」と称する。

式(ω-20A)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素

ースルホニル基」(具体例：メタンスルホニル、ベンゼンスルホニル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルホニル基」と称する。

式($\omega-21A$)で表される基の中で、 R^{a1} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルフィニル基」(具体例：メチルスルフィニル、ベンゼンスルフィニル等の基)、 R^{a1} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルフィニル基」と称する。

上記式($\omega-1A$)ないし($\omega-21A$)で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式($\omega-1A$)で表される「炭化水素ーカルボニル基」としては、アルキルーカルボニル基、アルケニルーカルボニル基、アルキニルーカルボニル基、シクロアルキルーカルボニル基、シクロアルケニルーカルボニル基、シクロアルカンジエニルーカルボニル基、シクロアルキルーアルキルーカルボニル基等の脂肪族炭化水素ーカルボニル基；アリールーカルボニル基；アラルキルーカルボニル基；架橋環式炭化水素ーカルボニル基；スピロ環式炭化水素ーカルボニル基；テルペン系炭化水素ーカルボニル基が挙げられる。以下、式($\omega-2A$)ないし($\omega-21A$)で表される基も同様である。

上記式($\omega-1A$)ないし($\omega-21A$)で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式($\omega-1A$)で表される「ヘテロ環ーカルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリールーカルボニル基、縮合多環式ヘテロアリールーカルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環ーカルボニル基が挙げられる。以下、式($\omega-2A$)ないし($\omega-21A$)で表される基も同様である。

上記式($\omega-10A$)ないし($\omega-16A$)で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル基」、「カルバモイル基」、「チオカルバモイル基」、「スルファモイル基」、及び「スルフィナモイル基」を総称して、「置換基を有していてもよいアシル基」と称する。

本明細書において、ある官能基について「置換基を有していてもよい」という

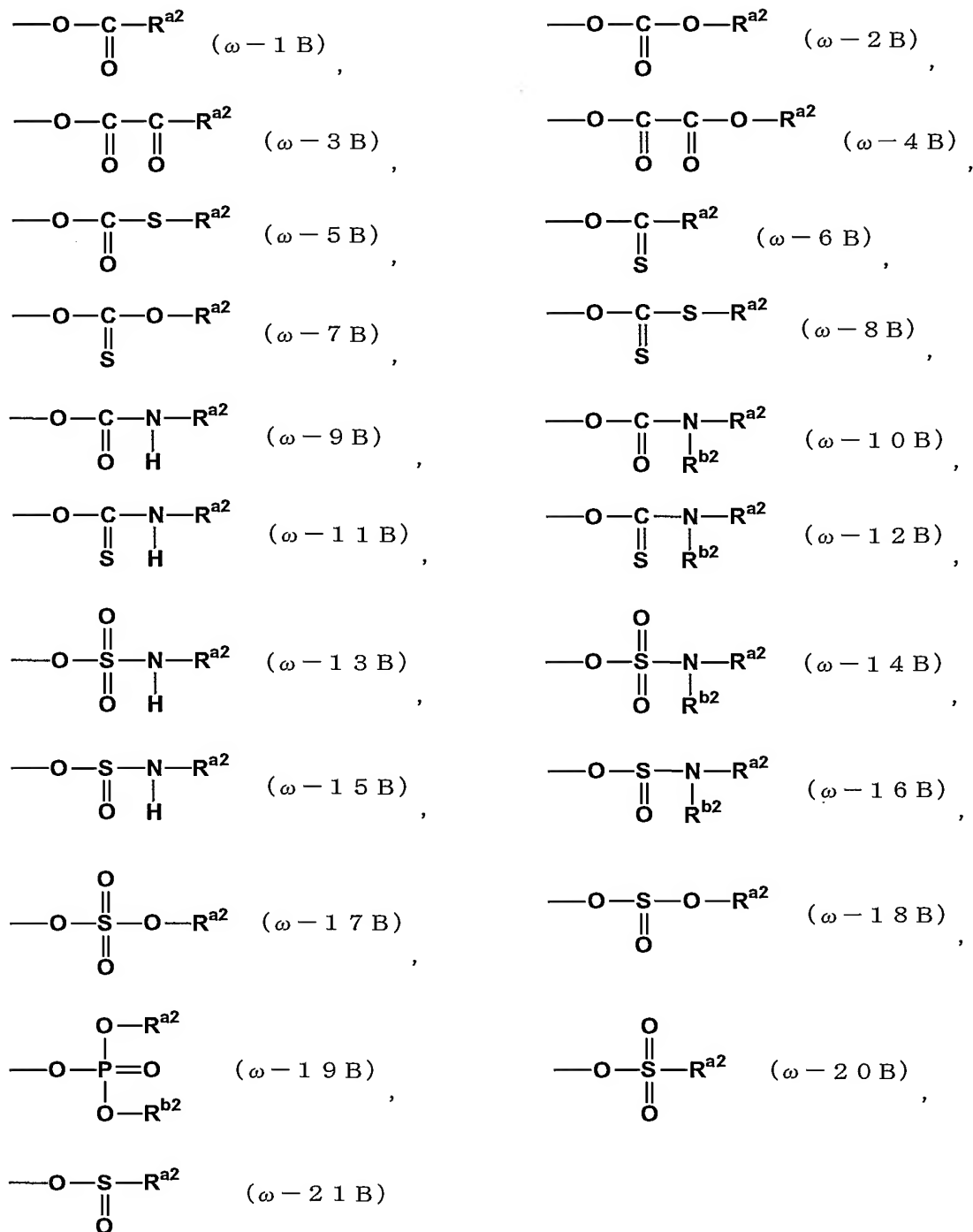
場合には、特に言及する場合を除き、その官能基が、化学的に可能な位置に 1 個又は 2 個以上の「置換基」を有する場合があることを意味する。官能基に存在する置換基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2 個以上の置換基が存在する場合には、それらは同一であっても異なってもよい。官能基に存在する「置換基」としては、例えば、ハロゲン原子、オキシ基、チオキシ基、ニトロ基、ニトロソ基、シアノ基、イソシアノ基、シアナト基、チオシアナト基、イソシアナト基、イソチオシアナト基、ヒドロキシ基、スルファニル基、カルボキシ基、スルファニルカルボニル基、オキサロ基、メソオキサロ基、チオカルボキシ基、ジチオカルボキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、スルホ基、スルファモイル基、スルフィノ基、スルフィナモイル基、スルフェノ基、スルフェナモイル基、ホスホノ基、ヒドロキシホスホニル基、炭化水素基、ヘテロ環基、炭化水素-オキシ基、ヘテロ環-オキシ基、炭化水素-スルファニル基、ヘテロ環-スルファニル基、アシル基、アミノ基、ヒドラジノ基、ヒドラゾノ基、ジアゼニル基、ウレイド基、チオウレイド基、グアニジノ基、カルバモイミドイル基（アミジノ基）、アジド基、イミノ基、ヒドロキシアミノ基、ヒドロキシイミノ基、アミノオキシ基、ジアゾ基、セミカルバジノ基、セミカルバゾノ基、アロファニル基、ヒダントイル基、ホスファノ基、ホスホロソ基、ホスホ基、ボリル基、シリル基、スタニル基、セラニル基、オキシド基等を挙げることができる。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」が 2 個以上存在する場合、該 2 個以上の置換基は、それらが結合している原子と一緒になって環式基を形成してもよい。このような環式基には、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子 1 ないし 3 種が 1 個以上含有されていてもよく、該環上には 1 個以上の置換基が存在していてもよい。該環は、単環式又は縮合多環式のいずれであってもよく、芳香族又は非芳香族のいずれであってもよい。

上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」は、該置換基上の化学的に可能な位置で、上記「置換基」によって置換されていてもよい。置換

基の種類、置換基の個数、及び置換位置は特に限定されず、2個以上の置換基で置換される場合には、それらは同一であっても異なってもよい。そのような例として、例えば、ハロゲン化アルキル-カルボニル基（具体例：トリフルオロアセチル等の基）、ハロゲン化アルキル-スルホニル基（具体例：トリフルオロメタンスルホニル等の基）、アシル-オキシ基、アシル-スルファニル基、N-炭化水素基-アミノ基、N，N-ジ（炭化水素）-アミノ基、N-ヘテロ環-アミノ基、N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基、アシル-アミノ基、ジ（アシル）-アミノ基等の基が挙げられる。又、上記「置換基」上での「置換」は複数次にわたって繰り返されてもよい。

「アシル-オキシ基」としては、「ヒドロキシ基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルオキシ基、グリオキシロイルオキシ基、チオホルミルオキシ基、及び下記式：



(式中、 R^{a2} 及び R^{b2} は、同一又は異なって、炭化水素基、又はヘテロ環基を表すか、或いは R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルーオキシ基」の定義において、

式 ($\omega-1B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーオキシ基」(具体例: アセトキシ、ベンゾイルオキシ等の基)、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-2B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-3B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-4B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-5B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-6B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-7B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-8B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーチオカルボニルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーオキシ基」と称する。

式 ($\omega-9B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーカルバモイルーオキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ーカルバモイルーオキシ基」と称する。

式($\omega-10B$)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-カルボニル-オキシ基」と称する。

式($\omega-11B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」と称する。

式($\omega-12B$)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-チオカルボニル-オキシ基」と称する。

式($\omega-13B$)で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイル-オキシ基」と称する。

式($\omega-14B$)で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルホニル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-15B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-16B$) で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルフィニル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-17B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-18B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-19B$) で表される基の中で、 R^{a2} 及び R^{b2} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ-オキシ基」、 R^{a2} 及び R^{b2} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ-オキシ基」、 R^{a2} が炭化水素基であり R^{b2} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素置換-O'-ヘテロ環置換ホスホノ-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-20B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル-オキシ基」と称する。

式 ($\omega-21B$) で表される基の中で、 R^{a2} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル-オキシ基」、 R^{a2} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニル-オキシ基」と称する。

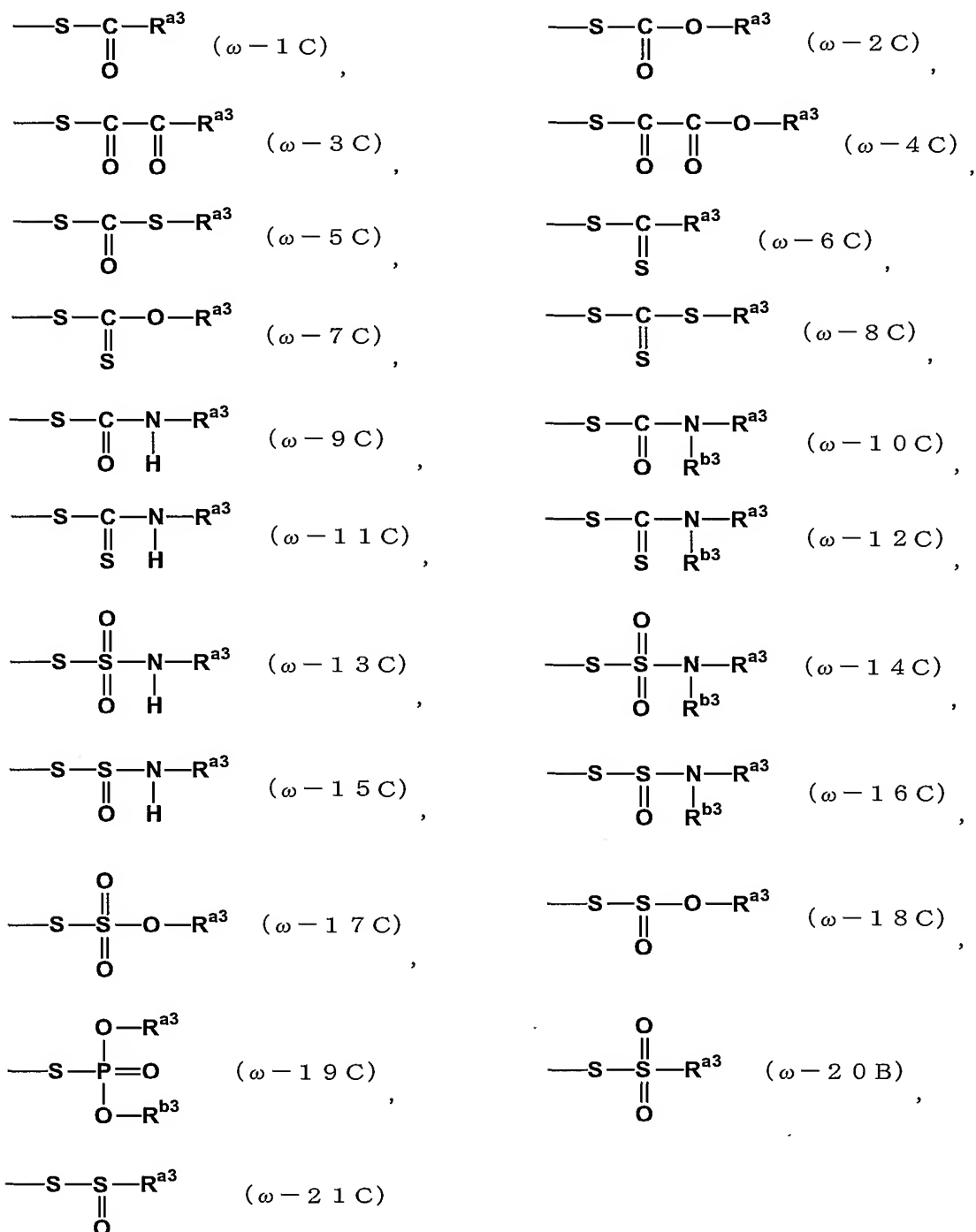
上記式 ($\omega-1B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1B$) で表される「炭化水素-カルボニル-オキシ基」としては、アルキル-カルボニル-オキシ基、アルケニル-カルボニル-オキシ基、アルキニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルキル-カルボニル-オキシ基、シクロアルケニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-オキシ基、シクロアルキル-アルキル-カルボニル-オキシ基等の脂肪族炭化水素-カルボニル-オキシ基；アリール-カルボニル-オキシ基；アラルキル-カルボニル-オキシ基；架橋環式炭化水素-カルボニル-オキシ基；スピロ環式炭化水素-カルボニル-オキシ基；テルペン系炭化水素-カルボニル-オキシ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1B$) で表される「ヘテロ環-カルボニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニル基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2B$) ないし ($\omega-21B$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10B$) ないし ($\omega-16B$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル-オキシ基」、「炭化水素-オキシ基」、及び「ヘテロ環-オキシ基」を総称して、「置換オキシ基」と称する。又、これら「置換オキシ基」と「ヒドロキシ基」を総称して、「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と称する。

「アシル-スルファニル基」としては、「スルファニル基」の水素原子が「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルスルファニル基、グリオキシロイルスルファニル基、チオホルミルスルファニル基、及び下記式：



(式中、 R^{a3} 及び R^{b3} は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、或いは R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」の定義において、

式 ($\omega-1$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-2$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-3$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-4$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-5$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-6$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-7$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-8$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーチオカルボニルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルースルファニル基」と称する。

式 ($\omega-9$ C) で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーカルバモイルースルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「Nーヘテ

「 ω -カルバモイルスルファニル基」と称する。

式($\omega-10C$)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノカルボニルスルファモイル基」と称する。

式($\omega-11C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイルスルファニル基」と称する。

式($\omega-12C$)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノチオカルボニルスルファニル基」と称する。

式($\omega-13C$)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイルスルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイルスルファニル基」と称する。

式($\omega-14C$)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルファモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルファモイルスルフィニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環スルファモイルスルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノスルホニ

ルースルファニル基」と称する。

式(ω-15C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-スルファニル基」と称する。

式(ω-16C)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルファニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-17C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-18C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-19C)で表される基の中で、 R^{a3} 及び R^{b3} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ(炭化水素)-ホスホノ-スルファニル基」、 R^{a3} 及び R^{b3} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ(ヘテロ環)-ホスホノ-スルファニル基」、 R^{a3} が炭化水素基であり R^{b3} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ-スルファニル基」と称する。

式(ω-20C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル-スルファニル基」と称する。

式(ω-21C)で表される基の中で、 R^{a3} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル-スルファニル基」、 R^{a3} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-

スルフィニルースルファニル基」と称する。

上記式 ($\omega-1\text{C}$) ないし ($\omega-2\text{1C}$) で表される基における「炭化水素」としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1\text{C}$) で表される「炭化水素-カルボニルースルファニル基」としては、アルキル-カルボニルースルファニル基、アルケニル-カルボニルースルファニル基、アルキニル-カルボニルースルファニル基、シクロアルキル-カルボニルースルファニル基、シクロアルケニル-カルボニルースルファニル基、シクロアルカンジエニル-カルボニルースルファニル基、シクロアルキル-アルキル-カルボニルースルファニル基等の脂肪族炭化水素-カルボニルースルファニル基；アリール-カルボニルースルファニル基；アラルキル-カルボニルースルファニル基；架橋環式炭化水素-カルボニルースルファニル基；スピロ環式炭化水素-カルボニルースルファニル基；テルペン系炭化水素-カルボニルースルファニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2\text{C}$) ないし ($\omega-2\text{1C}$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1\text{C}$) ないし ($\omega-2\text{1C}$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1\text{C}$) で表される「ヘテロ環-カルボニルースルファニル基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニルースルファニル基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニルースルファニル基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニルースルファニル基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニルースルファニル基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2\text{C}$) ないし ($\omega-2\text{1C}$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1\text{0C}$) ないし ($\omega-1\text{6C}$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシルースルファニル基」、「炭化水素-スルファニル基」、及び「ヘテロ環-スルファニル基」を総称して、「置換スルファニル基」と称する。又、これら「置換スルファニル基」と「スルファニル基」を総称して、「置換基を有していてもよいスルファニル基」と称する。

「N-炭化水素-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「炭

化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N-アルキル-アミノ基、N-アルケニル-アミノ基、N-アルキニル-アミノ基、N-シクロアルキル-アミノ基、N-シクロアルキル-アルキル-アミノ基、N-アリール-アミノ基、N-アラルキル-アミノ基等が挙げられる。

「N-アルキル-アミノ基」としては、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、n-ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、n-ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、(2-メチルブチル)アミノ、(1-メチルブチル)アミノ、ネオペンチルアミノ、(1, 2-ジメチルプロピル)アミノ、(1-エチルプロピル)アミノ、n-ヘキシルアミノ、(4-メチルペンチル)アミノ、(3-メチルペンチル)アミノ、(2-メチルペンチル)アミノ、(1-メチルペンチル)アミノ、(3, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2, 2-ジメチルブチル)アミノ、(1, 1-ジメチルブチル)アミノ、(1, 2-ジメチルブチル)アミノ、(1, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2, 3-ジメチルブチル)アミノ、(2-エチルブチル)アミノ、(1-エチルブチル)アミノ、(1-エチル-1-メチルプロピル)アミノ、n-ヘプチルアミノ、n-オクチルアミノ、n-ノニルアミノ、n-デシルアミノ、n-ウンデシルアミノ、n-ドデシルアミノ、n-トリデシルアミノ、n-テトラデシルアミノ、n-ペンタデシルアミノ等のC₁~C₁₅の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキル-アミノ基が挙げられる。

「N-アルケニル-アミノ基」としては、例えば、ビニルアミノ、(プロパー1-エン-1-イル)アミノ、アリルアミノ、イソプロペニルアミノ、(ブター1-エン-1-イル)アミノ、(ブター2-エン-1-イル)アミノ、(ブター3-エン-1-イル)アミノ、(2-メチルプロパー2-エン-1-イル)アミノ、(1-メチルプロパー2-エン-1-イル)アミノ、(ペンター1-エン-1-イル)アミノ、(ペンター2-エン-1-イル)アミノ、(ペンター3-エン-1-イル)アミノ、(ペンター4-エン-1-イル)アミノ、(3-メチルブター2-エン-1-イル)アミノ、(3-メチルブター3-エン-1-イル)アミノ、(ヘ

キサ-1-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-2-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-3-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-4-エン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル) アミノ、(4-メチルペンタ-3-エン-1-イル) アミノ、(ヘプタ-1-エン-1-イル) アミノ、(ヘプタ-6-エン-1-イル) アミノ、(オクタ-1-エン-1-イル) アミノ、(オクタ-7-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-エン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-エン-1-イル) アミノ、(デカ-1-エン-1-イル) アミノ、(デカ-9-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-10-エン-1-イル) アミノ、(ドデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ドデカ-11-エン-1-イル) アミノ、(トリデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(トリデカ-12-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-13-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1-エン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-14-エン-1-イル) アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルケニル-アミノ基が挙げられる。

「N-アルキニル-アミノ基」としては、例えば、エチニルアミノ、(プロパ-1-イン-1-イル) アミノ、(プロパ-2-イン-1-イル) アミノ、(ブタ-1-イン-1-イル) アミノ、(ブタ-3-イン-1-イル) アミノ、(1-メチルプロパ-2-イン-1-イル) アミノ、(ペンタ-1-イン-1-イル) アミノ、(ペンタ-4-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-1-イン-1-イル) アミノ、(ヘキサ-5-イン-1-イル) アミノ、(ヘプタ-1-イン-1-イル、(ヘプタ-6-イン-1-イル) アミノ、(オクタ-1-イン-1-イル) アミノ、(オクタ-7-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-1-イン-1-イル) アミノ、(ノナ-8-イン-1-イル) アミノ、(デカ-1-イン-1-イル) アミノ、(デカ-9-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ウンデカ-10-イン-1-イル) アミノ、(ドデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ドデカ-11-イン-1-イル) アミノ、(トリデカ-1-イン-1-

イル) アミノ、(トリデカ-1 2-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(テトラデカ-1 3-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1-イン-1-イル) アミノ、(ペンタデカ-1 4-イン-1-イル) アミノ等の $C_2 \sim C_{15}$ の直鎖状又は分枝鎖状のN-アルキルアミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキルアミノ基」としては、例えば、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、シクロヘプチルアミノ、シクロオクチルアミノ等の $C_3 \sim C_8$ のN-シクロアルキルアミノ基が挙げられる。

「N-シクロアルキル-アルキルアミノ基」としては、例えば、(シクロプロピルメチル) アミノ、(1-シクロプロピルエチル) アミノ、(2-シクロプロピルエチル) アミノ、(3-シクロプロピルプロピル) アミノ、(4-シクロプロピルブチル) アミノ、(5-シクロプロピルペンチル) アミノ、(6-シクロプロピルヘキシル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロブチルメチル) アミノ、(シクロペンチルメチル) アミノ、(シクロヘキシルメチル) アミノ、(2-シクロヘキシルエチル) アミノ、(3-シクロヘキシルプロピル) アミノ、(4-シクロヘキシルブチル) アミノ、(シクロヘプチルメチル) アミノ、(シクロオクチルメチル) アミノ、(6-シクロオクチルヘキシル) アミノ等の $C_4 \sim C_{14}$ のN-シクロアルキル-アルキルアミノ基が挙げられる。

「N-アリールアミノ基」としては、例えば、フェニルアミノ、1-ナフチルアミノ、2-ナフチルアミノ、アントリルアミノ、フェナントリルアミノ、アセナフチレニルアミノ等の $C_6 \sim C_{14}$ のN-モノアリールアミノ基が挙げられる。

「N-アラルキルアミノ基」としては、例えば、ベンジルアミノ、(1-ナフチルメチル) アミノ、(2-ナフチルメチル) アミノ、(アントラセニルメチル) アミノ、(フェナントレニルメチル) アミノ、(アセナフチレニルメチル) アミノ、

(ジフェニルメチル) アミノ、(1-フェネチル) アミノ、(2-フェネチル) アミノ、(1-(1-ナフチル) エチル) アミノ、(1-(2-ナフチル) エチル) アミノ、(2-(1-ナフチル) エチル) アミノ、(2-(2-ナフチル) エチル) アミノ、(3-フェニルプロピル) アミノ、(3-(1-ナフチル) プロピル) アミノ、(3-(2-ナフチル) プロピル) アミノ、(4-フェニルブチル) アミノ、(4-(1-ナフチル) ブチル) アミノ、(4-(2-ナフチル) ブチル) アミノ、(5-フェニルペンチル) アミノ、(5-(1-ナフチル) ペンチル) アミノ、(5-(2-ナフチル) ペンチル) アミノ、(6-フェニルヘキシル) アミノ、(6-(1-ナフチル) ヘキシル) アミノ、(6-(2-ナフチル) ヘキシル) アミノ等のC₇~C₁₆のN-アラルキルーアミノ基が挙げられる。

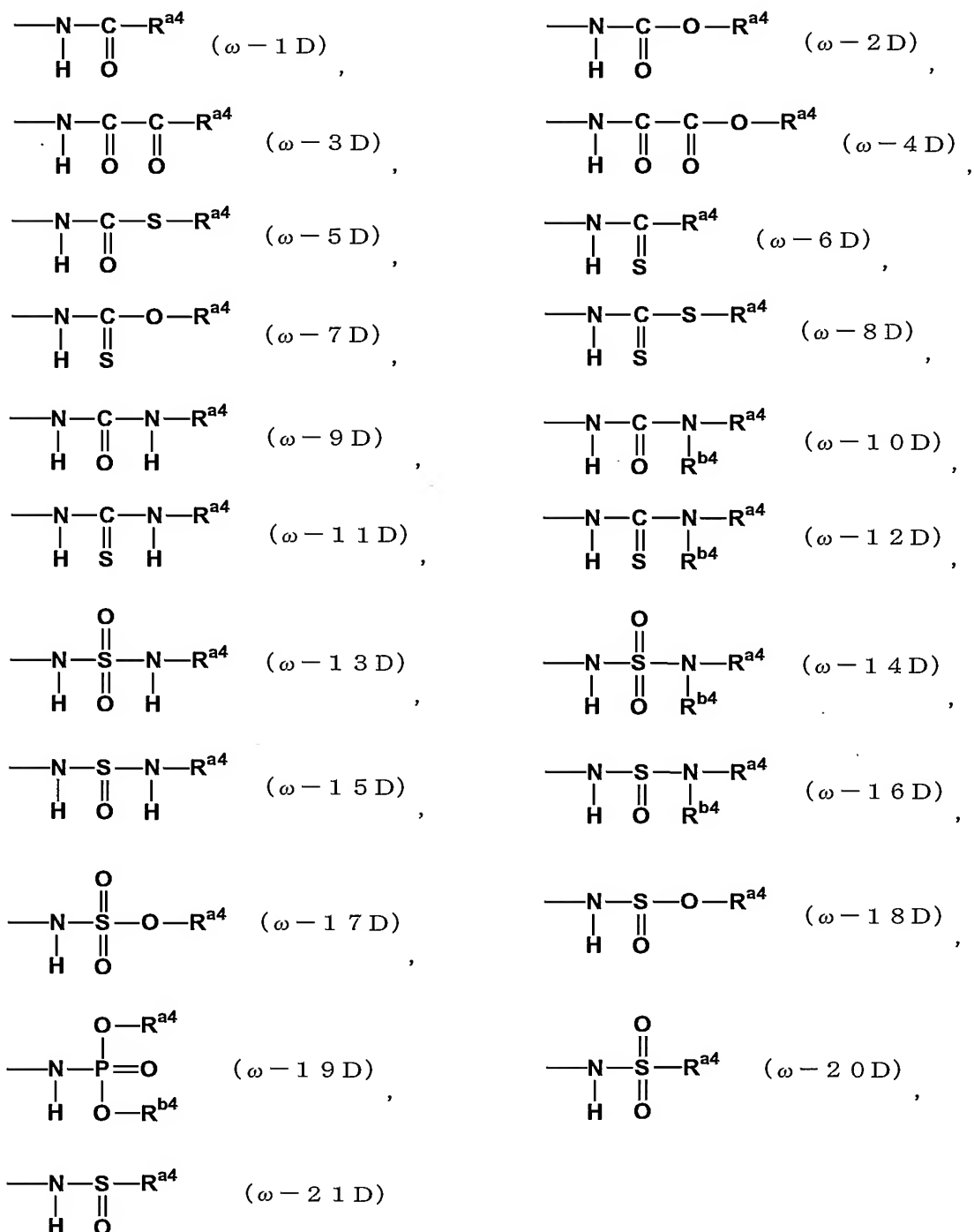
「N, N-ジ(炭化水素)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」で置換された基が挙げられ、例えば、N, N-ジメチルアミノ、N, N-ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、N, N-ジ-n-プロピルアミノ、N, N-ジイソプロピルアミノ、N-アリル-N-メチルアミノ、N-(プロパー-2-イン-1-イル)-N-メチルアミノ、N, N-ジシクロヘキシルアミノ、N-シクロヘキシル-N-メチルアミノ、N-シクロヘキシルメチルアミノ-N-メチルアミノ、N, N-ジフェニルアミノ、N-メチル-N-フェニルアミノ、N, N-ジベンジルアミノ、N-ベンジル-N-メチルアミノ等の基が挙げられる。

「N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つ水素原子が、「ヘテロ環基」で置換された基が挙げられ、例えば、(3-ピロリジニル) アミノ、(4-ピペリジニル) アミノ、(2-テトラヒドロピラニル) アミノ、(3-インドリニル) アミノ、(4-クロマニル) アミノ、(3-チエニル) アミノ、(3-ピリジル) アミノ、(3-キノリル) アミノ、(5-インドリル) アミノ等の基が挙げられる。

「N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、「炭化水素基」及び「ヘテロ環基」で1つずつ置換された基が挙げ

られ、例えば、N-メチル-N-(4-ピペリジニル) アミノ、N-(4-クロマニル)-N-メチルアミノ、N-メチル-N-(3-チエニル) アミノ、N-メチル-N-(3-ピリジル) アミノ、N-メチル-N-(3-キノリル) アミノ等の基が挙げられる。

「アシル-アミノ基」としては、「アミノ基」の1つの水素原子が、「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ホルミルアミノ基、グリオキシロイルアミノ基、チオホルミルアミノ基、及び下記式：



(式中、 R^{a4} 及び R^{b4} は、同一又は異なって、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、或いは R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す) で表される基が挙げられる。

上記「アシルーアミノ基」の定義において、

式 ($\omega-1D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-2D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-3D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-4D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-5D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-6D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-7D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ーオキシーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-8D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素ースルファニルーチオカルボニルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニルーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-9D$) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「Nー炭化水素ーカルバモイル基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「Nーヘテロ環ーカルバモ

イルーアミノ基」と称する。

式($\omega-10D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-カルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-カルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-カルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-11D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-チオカルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-チオカルバモイルーアミノ基」と称する。

式($\omega-12D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ(炭化水素)-チオカルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)-チオカルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-チオカルボニルーアミノ基」と称する。

式($\omega-13D$)で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルファモイルーアミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルファモイルーアミノ基」と称する。

式($\omega-14D$)で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「ジ(炭化水素)スルファモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ(ヘテロ環)スルファモイルーアミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイルーアミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルホニルーアミノ基」と称する。

式 (ω-15D) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「N-炭化水素-スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」と称する。; 式 (ω-16D) で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「N, N-ジ (炭化水素) -スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「N, N-ジ (ヘテロ環) -スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルフィナモイル-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「環状アミノ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 (ω-17D) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルホニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 (ω-18D) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-オキシ-スルフィニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-オキシ-スルフィニル-アミノ基」と称する。

式 (ω-19D) で表される基の中で、 R^{a4} 及び R^{b4} が炭化水素基である基を「O, O'-ジ (炭化水素) -ホスホノ-アミノ基」、 R^{a4} 及び R^{b4} がヘテロ環基である基を「O, O'-ジ (ヘテロ環) -ホスホノ-アミノ基」、 R^{a4} が炭化水素基であり R^{b4} がヘテロ環基である基を「O-炭化水素-O'-ヘテロ環-ホスホノ-アミノ基」と称する。

式 (ω-20D) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルホニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルホニル-アミノ基」と称する。

式 (ω-21D) で表される基の中で、 R^{a4} が炭化水素基である基を「炭化水素-スルフィニル-アミノ基」、 R^{a4} がヘテロ環基である基を「ヘテロ環-スルフィニル-アミノ基」と称する。

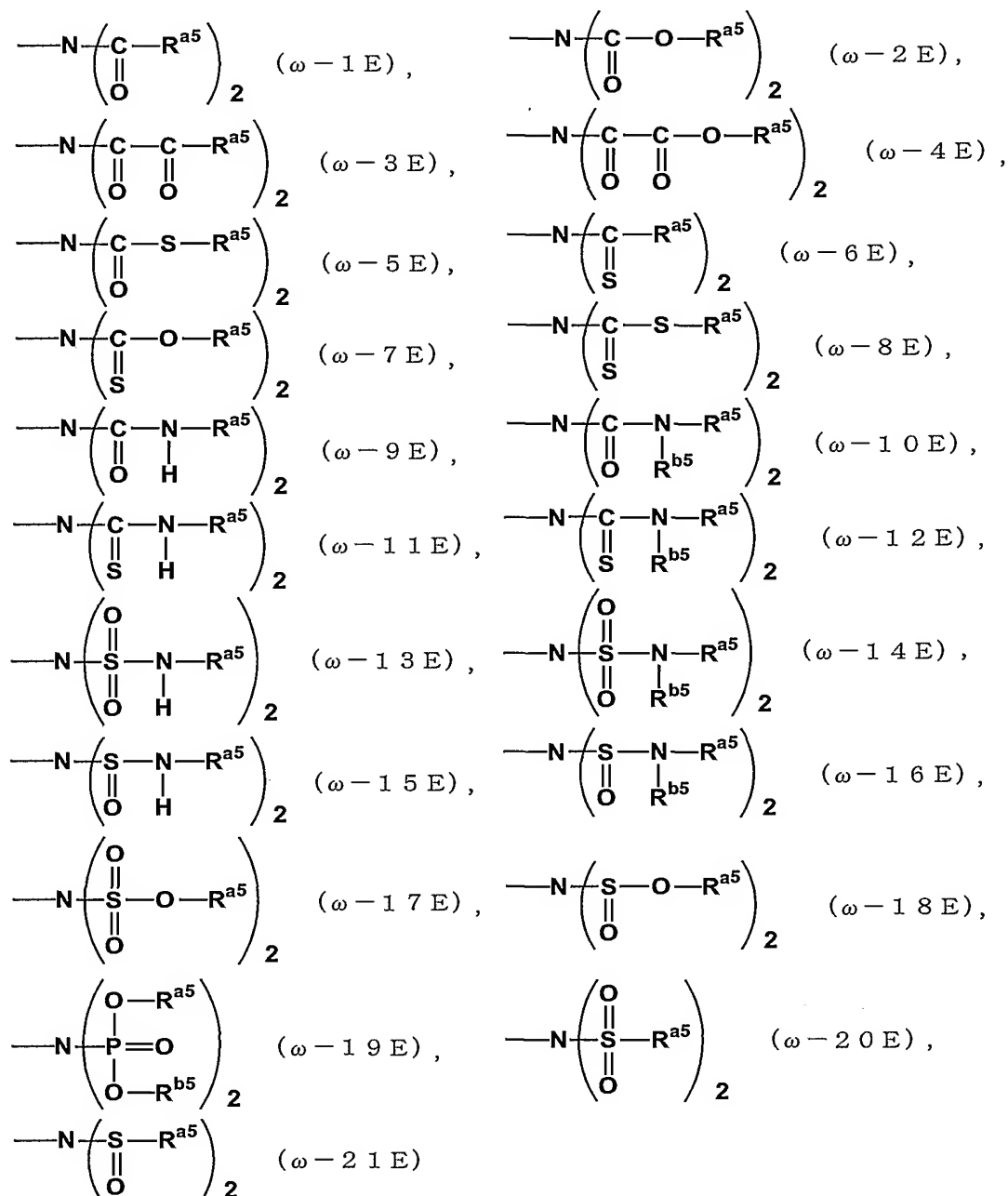
上記式 (ω-1D) ないし (ω-21D) で表される基における「炭化水素」

としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1D$) で表される「炭化水素-カルボニル-アミノ基」としては、アルキル-カルボニル-アミノ基、アルケニル-カルボニル-アミノ基、アルキニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルキル-カルボニル-アミノ基、シクロアルケニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルカンジエニル-カルボニル-アミノ基、シクロアルキル-アルキル-カルボニル-アミノ基等の脂肪族炭化水素-カルボニル-アミノ基；アリール-カルボニル-アミノ基；アラルキル-カルボニル-アミノ基；架橋環式炭化水素-カルボニル-アミノ基；スピロ環式炭化水素-カルボニル-アミノ基；テルペン系炭化水素-カルボニル-アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1D$) で表される「ヘテロ環-カルボニル-アミノ基」としては、例えば、単環式ヘテロアリール-カルボニル-アミノ基、縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル-アミノ基、単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル-アミノ基、縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル-アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2D$) ないし ($\omega-21D$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10D$) ないし ($\omega-16D$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

「ジ(アシル)-アミノ基」としては、「アミノ基」の2つの水素原子が、上記「置換基を有していてもよい」の「置換基」の定義における「アシル基」で置換された基が挙げられ、例えば、ジ(ホルミル)-アミノ基、ジ(グリオキシロイル)-アミノ基、ジ(チオホルミル)-アミノ基、及び下記式：



(式中、 R^{a5} 及び R^{b5} は、同一又は異なって、水素原子、置換基を有していてもよい炭化水素基、又は置換基を有していてもよいヘテロ環基を表すか、或いは R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に、置換基を有していてもよい環状アミノ基を表す)で表される基があげられる

上記「ジ(アシル)ーアミノ基」の定義において、
式($\omega-1 \text{ E}$)で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス(炭化水素

ーカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-2E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ーオキシーカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーオキシーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-3E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-4E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ーオキシーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーオキシーカルボニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-5E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ースルファニルーカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ースルファニルーカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-6E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ーチオカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-7E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ーオキシーチオカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ーオキシーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-8E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環ースルファニルーチオカルボニル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-9E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (Nー炭化水素ーカルバモイル) アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (Nーヘテロ環ーカルバモイル)ーアミノ基」と称する。

式 ($\omega-10E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス

「N, N-ジ（炭化水素）-カルバモイル」-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ（ヘテロ環）-カルバモイル」-アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-カルバモイル）-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-カルボニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-11E$ ）で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス（N-炭化水素-チオカルバモイル）-アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス（N-ヘテロ環-チオカルバモイル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-12E$ ）で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, N-ジ（炭化水素）-チオカルバモイル」-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ（ヘテロ環）-チオカルバモイル」-アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-チオカルバモイル）-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-チオカルボニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-13E$ ）で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス（N-炭化水素-スルファモイル）-アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス（N-ヘテロ環-スルファモイル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-14E$ ）で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, N-ジ（炭化水素）-スルファモイル」-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, N-ジ（ヘテロ環）-スルファモイル」-アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス（N-炭化水素-N-ヘテロ環-スルファモイル）-アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス（環状アミノ-スルホニル）-アミノ基」と称する。

式（ $\omega-15E$ ）で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス（N-炭

化水素－スルフィナモイル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (N－ヘテロ環－スルフィナモイル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-16E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [N, N－ジ (炭化水素)－スルフィナモイル]－アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [N, N－ジ (ヘテロ環)－スルフィナモイル]－アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (N－炭化水素－N－ヘテロ環－スルフィナモイル)－アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} が一緒になって、それらが結合している窒素原子と共に環状アミノ基である基を「ビス (環状アミノ－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-17E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－オキシ－スルホニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－オキシ－スルホニル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-18E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－オキシ－スルフィニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－オキシ－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-19E$) で表される基で、 R^{a5} 及び R^{b5} が炭化水素基である基を「ビス [O, O'－ジ (炭化水素)－ホスホノ]－アミノ基」、 R^{a5} 及び R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス [O, O'－ジ (ヘテロ環)－ホスホノ]－アミノ基」、 R^{a5} が炭化水素基であり R^{b5} がヘテロ環基である基を「ビス (O－炭化水素－O'－ヘテロ環－ホスホノ)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-20E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－スルホニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルホニル)－アミノ基」と称する。

式 ($\omega-21E$) で表される基で、 R^{a5} が炭化水素基である基を「ビス (炭化水素－スルフィニル)－アミノ基」、 R^{a5} がヘテロ環基である基を「ビス (ヘテロ環－スルフィニル)－アミノ基」と称する。

上記式 ($\omega-1E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基における「炭化水素」

としては、上記「炭化水素基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1E$) で表される「ビス (炭化水素-カルボニル) -アミノ基」としては、ビス (アルキル-カルボニル) -アミノ基、ビス (アルケニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (アルキニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルキル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルケニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルカンジエニル-カルボニル) -アミノ基、ビス (シクロアルキル-アルキル-カルボニル) -アミノ基等のビス (脂肪族炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (アリール-カルボニル) -アミノ基；ビス (アラルキル-カルボニル) -アミノ基；ビス (架橋環式炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (スピロ環式炭化水素-カルボニル) -アミノ基；ビス (テルペン系炭化水素-カルボニル) -アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-1E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基における「ヘテロ環」としては、上記「ヘテロ環基」と同様の基が挙げられる。例えば、式 ($\omega-1E$) で表される「ビス (ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基」としては、例えば、ビス (単環式ヘテロアリール-カルボニル) -アミノ基、ビス (縮合多環式ヘテロアリール-カルボニル) -アミノ基、ビス (単環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基、ビス (縮合多環式非芳香族ヘテロ環-カルボニル) -アミノ基が挙げられる。以下、式 ($\omega-2E$) ないし ($\omega-21E$) で表される基も同様である。

上記式 ($\omega-10E$) ないし ($\omega-16E$) で表される基における「環状アミノ」としては、上記「環状アミノ基」と同様の基が挙げられる。

上記「アシル-アミノ基」及び「ジ (アシル) -アミノ基」を総称して、「アシル置換アミノ基」と称する。又、上記「N-炭化水素-アミノ基」、「N, N-ジ (炭化水素) -アミノ基」、「N-ヘテロ環-アミノ基」、「N-炭化水素-N-ヘテロ環-アミノ基」、「環状アミノ基」、「アシル-アミノ基」、及び「ジ (アシル) -アミノ基」を総称して、「置換アミノ基」と称する。さらに、これら「置

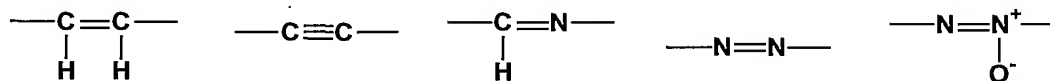
換アミノ基」と「アミノ基」を総称して、「置換基を有していてもよいアミノ基」と称する。

以下、上記一般式 (I)、(I-1)、(I-2)、(I-3)、(I-4) で表される化合物について具体的に説明する。

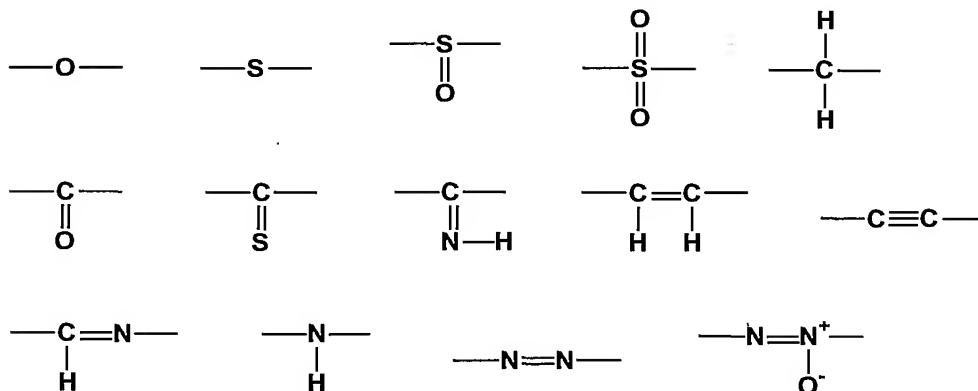
Xの定義における「主鎖の原子数が2ないし4である連結基」とは、環ZとEの間に、主鎖の原子が2ないし4個連なっている連結基を意味する。上記「主鎖の原子数」は、ヘテロ原子の有無に関わらず、環ZとEとの間に存在する原子の数が最小となるように数えるものとする。例えば、1, 2-シクロペンチレンの原子数を2個、1, 3-シクロペンチレンの原子数を3個、1, 4-フェニレンの原子数を4個、2, 6-ピリジンジイルの原子数を3個として数える。

上記「主鎖の原子数が2ないし4である連結基」は、下記2価基群 α -1より選択される基1個で形成されるか、或いは、下記2価基群 α -2より選択される基1ないし4種が2ないし4個結合して形成される。

[2価基群 α -1] 下記式：



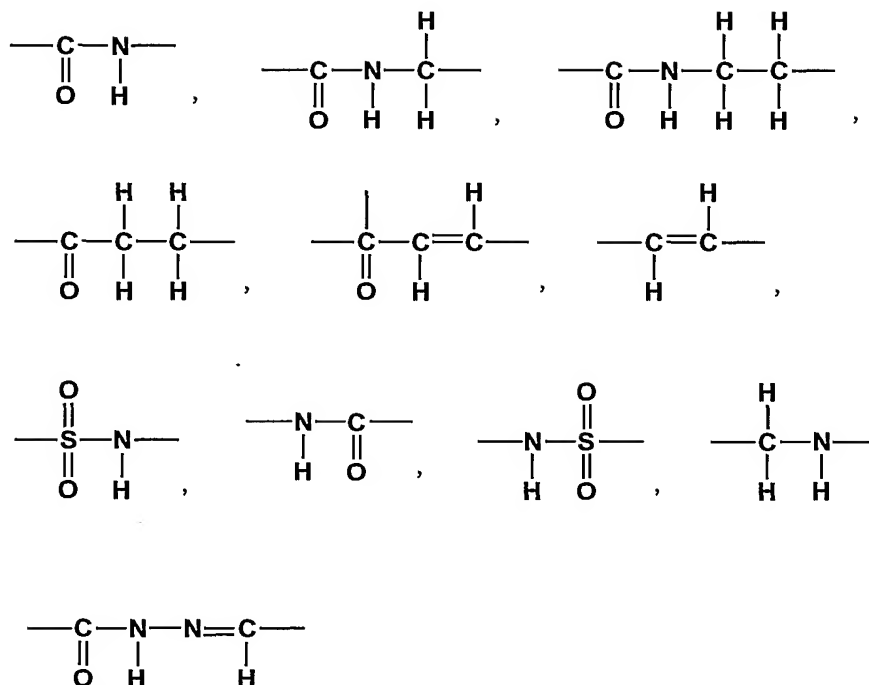
[2価基群 α -2] 下記式：



該2価基が2個以上結合する場合、各基は同一であっても異なってもよい。

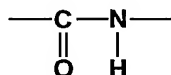
上記「主鎖の原子数が2ないし4である連結基」としては、好適には、下記連結基群 α より選択される基である。

[連結基群 α] 下記式：



(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)

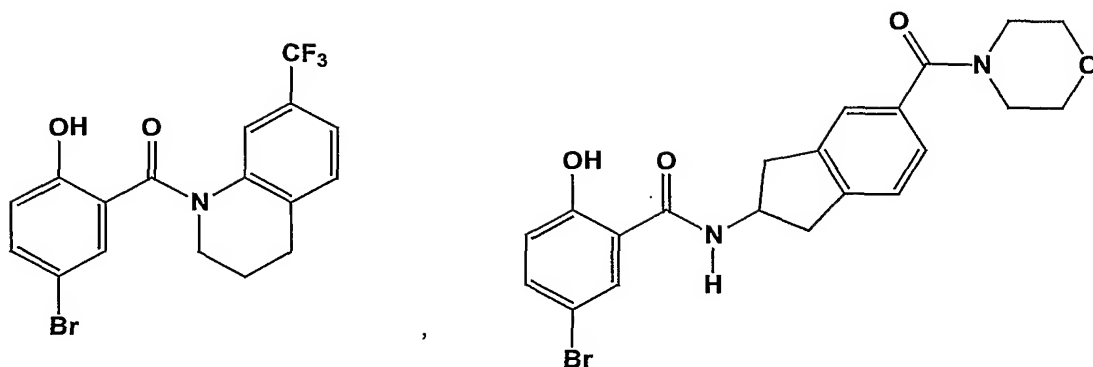
最も好適には、下記式：



(式中、左側の結合手が環 Z に結合し右側の結合手が E に結合する)

で表される基である。

「主鎖の原子数が 2 ないし 4 である連結基」の定義における「該連結基は置換基を有していてもよい」の置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられ、好適には、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、さらに好適には、メチル基である。該置換基は、環 Z 又は E が有する置換基と一緒にあって、それらが結合している原子と共に、置換基を有していてもよい環式基を形成してもよい。このような例としては、一般式 (I) で表される化合物が、下記式：

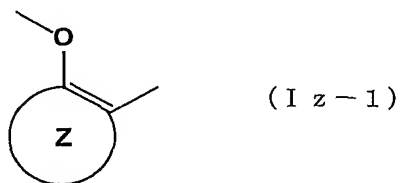


である化合物が挙げられる。

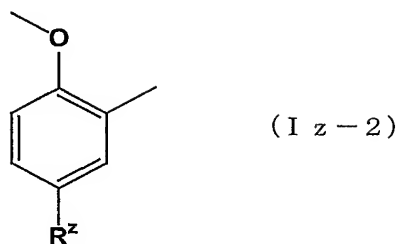
上記一般式 (I) において、A としては、水素原子又はアセチル基を挙げることができ、好適には水素原子である。

環 Z の定義における「置換基を有していてもよいアレーン」の「アレーン」としては、単環式又は縮合多環式芳香族炭化水素が挙げられ、例えば、ベンゼン環、ナフタレン環、アンラセン環、フェナントレン環、アセナフチレン環等が挙げられる。好適には、ベンゼン環、ナフタレン環等の $C_6 \sim C_{10}$ のアレーンであり、さらに好適には、ベンゼン環及びナフタレン環であり、最も好適には、ベンゼン環である。

環 Z が、ベンゼン環である場合、「式-O-A (式中、A は一般式 (I) における定義と同義である) 及び式-X-E (式中、X 及び E は一般式 (I) における定義と同義である) で表される基の他にさらに置換基を有していてもよい」の「置換基」は、一般式 (I) における環 Z を含む下記部分構造式 (I z - 1) :



が下記式 (I z - 2) :



で表される場合の R^z の位置に存在することが好ましい。

環Zの定義における「置換基を有していてもよいヘテロアレーン」の「ヘテロアレーン」としては、環系を構成する原子（環原子）として、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子等から選択されたヘテロ原子1ないし3種を少なくとも1個含む単環式又は縮合多環式芳香族複素環が挙げられ、例えば、フラン環、チオフェン環、ピロール環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、イソチアゾール環、イミダゾール環、ピラゾール環、1, 2, 3-オキサジアゾール環、1, 2, 3-チアジアゾール環、1, 2, 3-トリアゾール環、ピリジン環、ピリダジン環、ピリミジン環、ピラジン環、1, 2, 3-トリアジン環、1, 2, 4-トリアジン環、1H-アゼピン環、1, 4-オキセピン環、1, 4-チアゼピン環、ベンゾフラン環、イソベンゾフラン環、ベンゾ〔b〕チオフェン環、ベンゾ〔c〕チオフェン環、インドール環、2H-イソインドール環、1H-インダゾール環、2H-インダゾール環、ベンゾオキサゾール環、1, 2-ベンゾイソオキサゾール環、2, 1-ベンゾイソオキサゾール環、ベンゾチアゾール環、1, 2-ベンゾイソチアゾール環、2, 1-ベンゾイソチアゾール環、1, 2, 3-ベンゾオキサジアゾール環、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール環、1, 2, 3-ベンゾチアジアゾール環、2, 1, 3-ベンゾチアジアゾール環、1H-ベンゾトリアゾール環、2H-ベンゾトリアゾール環、キノリン環、イソキノリン環、シンノリン環、キナゾリン環、キノキサリン環、フタラジン環、ナフチリジン環、1H-1, 5-ベンゾジアゼピン環、カルバゾール環、 α -カルボリン環、 β -カルボリン環、 γ -カルボリン環、アクリジン環、フェノキサジン環、フェノチアジン環、フェナジン環、フェナントリジン環、フェナントロリン環、チアントレン環、インドリジン環、フェノキサチイン環等の5ないし14員の単

環式又は縮合多環式芳香族複素環が挙げられる。好適には、6ないし13員の単環式又は縮合多環式芳香族複素環であり、さらに好適には、ピリジン環、インドール環、キノキサリン環、及びカルバゾール環である。

環Zの定義における「式-O-A（式中、Aは一般式（I）における定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは一般式（I）における定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよい」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられ、環Zが、「式-O-A（式中、Aは一般式（I）における定義と同義である）及び式-X-E（式中、X及びEは一般式（I）における定義と同義である）で表される基の他にさらに置換基を有していてもよいベンゼン環」である場合、該置換基としては、好適には、置換基群 $\gamma-1z$ として定義される、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいアシル基、置換基を有していてもよいウレイド基、置換基を有していてもよいチオウレイド基、及び置換基を有していてもよいジアゼニル基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と同様の基が挙げられ、該置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」としては、好適には、置換基を有していてもよい炭化水素-オキシ基であり、さらに好適には、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基であり、特にさらに好適には、メトキシ基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいアミノ基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいアミノ基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基を有していてもよいアミノ基」

と同様の基が挙げられ、該置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいアミノ基」としては、好適には、ジ（炭化水素）－アミノ基及び炭化水素－カルボニル－アミノ基であり、さらに好適には、ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）－アミノ基及び $C_6 \sim C_{10}$ のアリール－カルボニル－アミノ基であり、特にさらに好適には、ジメチルアミノ基及びベンゾイルアミノ基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよい炭化水素基」としては、好適には、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基、置換基を有していてもよい $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基、及び置換基を有していてもよい $C_7 \sim C_{16}$ のアラルキル基であり、さらに好適には、メチル基、tert-ブチル基、1-ヒドロキシエチル基、1-(メトキシイミノ)エチル基、1-[(ベンジルオキシ)イミノ]エチル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、フェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-フルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2-フェニルエテン-1-イル基、2,2-ジシアノエテン-1-イル基、2-シアノ-2-(メトキシカルボニル)エテン-1-イル基、2-カルボキシ-2-シアノエテン-1-イル基、エチニル基、フェニルエチニル基、(トリメチルシリル)エチニル基、フェニル基、及び2-フェネチル基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいヘテロ環基」の「置換基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいヘテロ環基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいヘテロ環基」とし

ては、好適には、置換基を有していてもよいヘテロアリアル基であり、さらに好適には、置換基を有していてもよい5ないし6員のヘテロアリアル基であり、特にさらに好適には、2-チエニル基、3-チエニル基、1-ピロリル基、2-メチルチアゾール-4-イル基、及び2-ピリジル基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいアシル基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいアシル基」としては、上記「置換基を有していてもよいアシル基」の定義において例示した基と同様の基が挙げられ、該置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいアシル基」としては、好適には、置換基を有していてもよいカルバモイル基、置換基を有していてもよいスルファモイル基、置換基を有していてもよい炭化水素-カルボニル基、置換基を有していてもよい炭化水素-オキシカルボニル基、置換基を有していてもよいヘテロ環-カルボニル基、及び置換基を有していてもよいヘテロ環-スルホニル基であり、さらに好適には、置換基を有していてもよいカルバモイル基、置換基を有していてもよいスルファモイル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル-カルボニル基、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシカルボニル基、置換基を有していてもよい5員のヘテロアリアル-スルホニル基、及び置換基を有していてもよい6員の非芳香族ヘテロ環-スルホニル基であり、さらに特に好適には、[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、ジメチルスルファモイル基、アセチル基、イソブチリル基、メトキシカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、4-ベンジルピペリジノカルボニル基、及び(ピロール-1-イル)スルホニル基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいウレイド基」の「置換基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいウレイド基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいウレイド基」とし

ては、好適には、3-フェニルウレイド基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいチオウレイド基」の「置換基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいチオウレイド基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいチオウレイド基」としては、好適には、(3-フェニル)チオウレイド基である。

置換基群 $\gamma-1z$ の定義における「置換基を有していてもよいジアゼニル基」の「置換基」、及び R^z の定義における「置換基を有していてもよいジアゼニル基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいジアゼニル基」としては、好適には、(4-ニトロフェニル)ジアゼニル基及び {[(4-ピリジン-2-イル)スルファモイル]フェニル}ジアゼニル基である。

R^z としては、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよいアミノ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、置換基を有していてもよいアシル基、置換基を有していてもよいウレイド基、置換基を有していてもよいチオウレイド基、及び置換基を有していてもよいジアゼニル基が挙げられ、最も好適には、ハロゲン原子である。

E の定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「アリール基」としては、上記「炭化水素基」の定義における「アリール基」と同様の基が挙げられ、好適には、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基等の $C_6 \sim C_{10}$ のアリール基であり、最も好適には、フェニル基である。

E の定義における「置換基を有していてもよいアリール基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。

E の定義における「置換基を有していてもよいフェニル基」としての好適な態様は、

(1) $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個の他に、さらに置換基を有していてもよい)

(2) $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 1 個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 1 個の他に、さらに置換基 (ただし、 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を除く) を有していてもよい)

(3) 置換基 (ただし、 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を除く) を有していてもよいフェニル基

である。

E の定義における「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個の他に、さらに置換基を有していてもよい)」の「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基」としては、上記「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基」の定義において例示した基と同様の基が挙げられる。該「(該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個の他に、さらに置換基を有していてもよい)」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個の他に、さらに置換基を有していてもよい)」としては、好適には、「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 2 個で置換されたフェニル基」であり、さらに好適には、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基及び 2, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基であり、最も好適には、3, 5-ビス (トリフルオロメチル) フェニル基である。

E の定義における「 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 1 個で置換されたフェニル基 (該フェニル基は $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基 1 個の他に、さらに置換基 (ただし、 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を除く) を有していてもよい)」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基 (ただし、 $C_1 \sim C_6$ のハロゲン化アルキル基は除く) が挙げら

れ、好適には、置換基群 $\gamma - 1 e$ として定義される、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、置換基を有していてもよいヒドロキシ基、置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよいヘテロ環基、及び置換基を有していてもよいスルファニル基である。

置換基群 $\gamma - 1 e$ の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」と同様の基が挙げられ、該置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいヒドロキシ基」としては、好適には、置換基を有していてもよい炭化水素-オキシ基であり、さらに好適には、置換基群 $\gamma - 2 e$ として定義される、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルコキシ基であり、特にさらに好適には、メトキシ基である。

置換基群 $\gamma - 1 e$ の定義における「置換基を有していてもよい炭化水素基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよい炭化水素基」としては、好適には、置換基群 $\gamma - 2 e$ として定義される、置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、さらに好適には、メチル基である。

置換基群 $\gamma - 1 e$ の定義における「置換基を有していてもよいヘテロ環基」の「置換基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げられる。該「置換基を有していてもよいヘテロ環基」としては、好適には、置換基群 $\gamma - 2 e$ として定義される、置換基を有していてもよい5ないし6員の非芳香族ヘテロ環基であり、さらに好適には、1-ピロリジニル基、及びモルホリノ基である。

置換基群 $\gamma - 1 e$ の定義における「置換基を有していてもよいスルファニル基」としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基を有していてもよいスルファニル基」と同様の基が挙げられ、該置換基としては、上記「置換基を有していてもよい」の定義における「置換基」と同様の基が挙げら

れる。該「置換基を有していてもよいスルファニル基」としては、好適には、置換基を有していてもよい炭化水素－スルファニル基であり、さらに好適には、置換基群 $\gamma-2e$ として定義される、置換基を有していてもよい $C_1\sim C_6$ のアルキルスルファニル基であり、特にさらに好適には、メチルスルファニル基である。

Eの定義における「 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基1個で置換されたフェニル基（該フェニル基は $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基1個の他に、さらに置換基（ただし、 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を除く）を有していてもよい）」の「 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基」としては、上記「 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基」と同様の基が挙げられ、好適には、1個以上のフッ素原子で置換された $C_1\sim C_6$ のアルキル基であり、さらに好適には、3個以上のフッ素原子で置換された $C_1\sim C_6$ のアルキル基であり、最も好適には、トリフルオロメチル基である。

Eの定義における「 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基1個で置換されたフェニル基（該フェニル基は $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基1個の他に、さらに置換基（ただし、 $C_1\sim C_6$ のハロゲン化アルキル基を除く）を有していてもよい）」としては、好適には、2-（トリフルオロメチル）フェニル基、3-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-フルオロ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-クロロ-4-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-フルオロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-クロロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、3-フルオロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、3-ブromo-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-クロロ-2-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-フルオロ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-クロロ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-ニトロ-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-ニトロ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-シアノ-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-メチル-3-（トリフルオロメチル）フェニル基、2-メチル-5-（トリフルオロメチル）フェニル基、4-メチル-3-（トリ